

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **18.08.1998**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **18.08.1997 19.12.1997**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **1997/055944 1997/068335**

(33) Země priority: **US US**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **17.05.2000**
(Věstník č. 5/2000)

(86) PCT číslo: **PCT/US98/17048**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO99/09000**

(21) Číslo dokumentu:

2000 - 371

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. C1. ⁷:

C 07 D 327/00	A 61 K 31/41
C 07 D 339/04	A 61 K 31/54
C 07 D 275/04	A 61 K 31/55
C 07 D 279/00	A 61 P 35/00
C 07 D 263/52	
C 07 D 281/00	
C 07 D 335/00	
C 07 D 337/00	
C 07 D 337/06	
C 07 D 337/16	
C 07 C 235/00	
A 61 K 31/38	
A 61 K 31/39	

(71) Přihlašovatel:

DUPONT PHARMACEUTICALS COMPANY,
Wilmington, DE, US;

(72) Původce:

Yao Wenqing, Kennett Square, PA, US;
Decicco Carl P., Newark, DE, US;

(74) Zástupce:

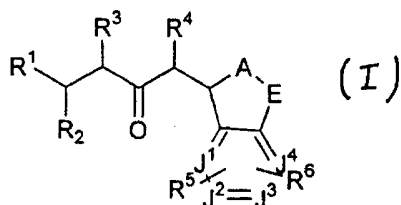
Čermák Karel Dr., Národní třída 32, Praha 1,
110 00;

(54) Název přihlášky vynálezu:

**Nové inhibitory aggreganazy a matricových
metaloproteináz pro léčbu artritidy**

(57) Anotace:

Sloučeniny obecného vzorce I jako inhibitory metaloproteináz
obsažených v degradovaných tkáních, a inhibitory pro
uvolnění nádorového nekrotického faktoru, farmaceutické
prostředky zahrnující uvedené sloučeniny a způsoby použití
těchto sloučenin při léčbě zánětlivých onemocnění.



Nové inhibitory aggrekanázy a matricových metaloproteináz pro léčbu artritidy

Oblast techniky

Vynález se týká nových molekul, které inhibují metaloproteinázy včetně aggrekanázy, produkce nádorového nekrotického faktoru (TNF), farmaceutických přípravků, obsahujících tyto molekuly, a jejich použití jako farmaceutických činidel. Tyto sloučeniny představují zejména inhibitory metaloproteináz, které se podílejí na degradaci tkání, a inhibitory pro uvolnění nádorového nekrotického faktoru.

Dosavadní stav techniky

Nyní se zjistilo, že metaloproteinázy (MP) jsou enzymy, které hrají důležitou roli při neřízené destrukci pojivové tkáně včetně proteoglykanu a kolagenu, která vede k resorpci extracelulární matrice. To je znakem mnoha patologických stavů, například kloubního revmatismu a osteoartritidy (zánětu kostí a kloubů), ulcerace rohovky, epidermální ulcerace nebo žaludečních vředů; nádorových metastáz nebo invaze; periodontálních chorob a nemoci kostí. Tyto katabolické enzymy jsou zpravidla mírně regulovány působením specifických inhibitorů, například alfa-2-makroglobulinů TIMP (tkáňového inhibitoru metaloproteinázy), které tvoří s MP inaktivní komplexy, na úrovni své syntézy a rovněž na úrovni extracelulární aktivity.

Osteoartritida a kloubní revmatismus (OA, resp. RA) jsou destruktivní choroby kloubní chrupavky, pro které je charakteristická lokalizovaná eroze povrchu chrupavky. Zjistilo se, že kloubní chrupavka hlavice stehenní kosti u pacientů trpících OA má například v porovnání s kontrolním vzorkem sníženou koncentraci zabudovaného radioaktivně

značeného síranu, což naznačuje zvýšenou míru degradace chrupavky v případě OA (Mankin a kol., J. Bone Joint Surg. 52A, 1970, 424 až 434). V savčích buňkách existují čtyři třídy proteinových degradačních enzymů: serinové, cysteinové, aspartové a metaloproteinázy. Z dostupných znalostí vyplývá, že je to právě metaloproteináza, která je odpovědná za degradaci extracelulární matrice kloubní chrupavky v případě OA a RA. U osteoartritické chrupavky bylo zjištěno zvýšení aktivity kolagenáz a stromelysinu, a tato aktivita korelovala se závažností léze (Mankin a kol., Arthritis Rheum. 21, 1978, 761 až 766, Woessner a kol., Arthritis Rheum. 26, 1983, 63 až 68 a Ibid. 27, 1984, 305 až 312). Kromě toho byla identifikována aggrekanáza (což je nově identifikovaná metaloproteinázová enzymatická aktivita), která představuje specifický štěpný produkt proteoglykanu, nalezeného u pacientů, trpících kloubním revmatismem a osteoartritidou (Lohmander L.S. a kol., Arthritis Rheum. 36, 1993, 1214 až 1222).

Metaloproteinázy (MP) se tedy jako klíčové enzymy podílejí na destrukci savčí chrupavky a kosti. Dá se očekávat, že patogenezi těchto chorob lze úspěšně modifikovat podáním MP inhibitorů a pro tyto účely byla navržena celá řada sloučenin (viz Wahl a kol., Ann. Rep. Med. Chem. 25, 175, až 184, AP, San Diego, 1990).

Předložený vynález popisuje makrocyclické molekuly, které inhibují aggrekanázu a další metaloproteinázy. Tyto nové molekuly jsou poskytnuty jako terapeutická činidla, která ochrání chrupavku. Inhibice aggrekanázy a dalších metaloproteináz těmito novými molekulami brání degradaci chrupavky popsányými enzymy, čímž zmírňuje patologické podmínky osteoartritidy a kloubního revmatismu.

Nádorově nekrotický faktor (TNF) je s buňkou spojený cytokin, který je zpracován z 26kD prekurzorové formy na 17kD aktivní

formu. Ukázalo se, že TNF je hlavním mediátorem zánětu, horečky a odezev akutní fáze u lidí a zvířat, které jsou podobné projevům, pozorovaným během akutní infekce a šoku. Nadbytek TNF se ukázal jako smrtelný. Nyní je zcela zřejmé, že blokace účinků TNF pomocí specifických protilátek může být za různých podmínek, zahrnujících autoimunitní choroby, například kloubní revmatismus (Feldman a kol., Lancet, 1994, 344, 1105), neinzulinově dependentní cukrovku (Lohmander L.S. a kol., Arthritis Rheum. 36, 1993, 1214 až 22) a Crohnovu chorobu (Macdonald T. a kol., Clin. Exp. Immunol. 81, 1990, 301), úspěšná.

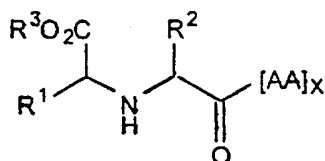
Sloučeniny, které inhibují produkci TNF jsou tedy terapeuticky důležité pro léčení zánětlivých poruch. Nedávno se ukázalo, že matricová metaloproteináza nebo rodina metaloproteináz, později známá jako TNF-konvertázy (TNF-C), a rovněž další MP jsou schopny štěpit TNF z jeho inaktivní formy na aktivní formu (Gearing a kol., Nature, 1994, 370, 555). Předložený vynález popisuje makrocyclické molekuly, které inhibují tuto konverzi a tím vylučují z buněk aktivní TNF- α . Tyto nové molekuly poskytují prostředek mechanismu, založeného na terapeutickém vměšování pro choroby, které zahrnují neomezujícím způsobem septický šok, hemodynamický šok, septický syndrom, postischemické reperfuční poškození, malárii, Crohnovu chorobu, zánětlivé střevní choroby, mykobakteriální infekci, meningitidu, psoriázu, městnavé srdeční selhání, fibrotické poruchy, kachexii, vypuzení štěpu, rakovinu, choroby zahrnující angiogenezi, autoimunitní choroby, kožní zánětlivé choroby, kloubní revmatismus, sklerózu multiplex, poškození způsobená radiací, hyperoxické alveolární poškození HIV a neinzulinově dependentní cukrovku.

Protože u vážných chorobných stavů, které jsou rovněž charakteristické tkáňovou degradací mediovanou pomocí MMP, byla zaznamenána nadbytečná produkce TNF, jsou pro choroby, u kterých probíhají oba mechanismy, zvláště výhodné sloučeniny,

které inhibují jak produkci MMP, tak produkci TNF.

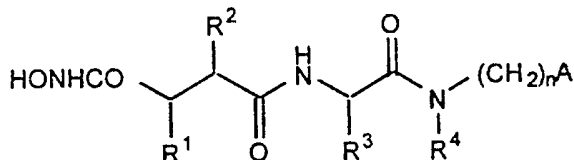
Existuje několik patentů, které popisují MMP inhibitory na bázi hydroxamátů a karboxylátů.

Mezinárodní publikace PCT WO 92/213260 popisuje N-karboxyalkylpeptidylové sloučeniny obecného vzorce:

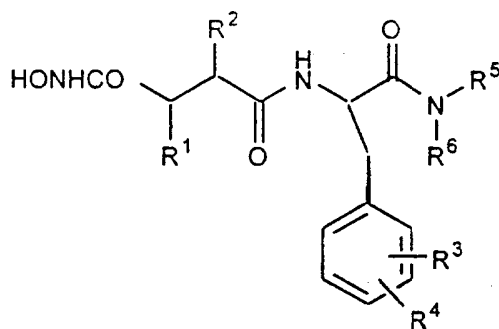


ve kterém AA znamená aminokyselinu jako inhibitory chorob mediovanych matricovou metaloproteinázou.

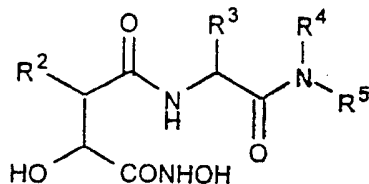
Mezinárodní publikace PCT WO 90/05716 popisuje kolagenázové inhibitory na bázi kyseliny hydroxamové, které mají obecný vzorec:



Mezinárodní publikace PCT WO 92/13831 popisuje příbuzné hydroxamové kyseliny, vykazující kolagenázovou inhibiční aktivitu, obecného vzorce:

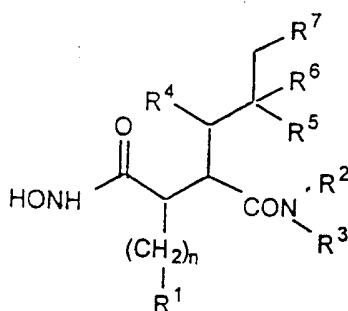


Mezinárodní publikace PCT WO 94/02446 popisuje metaloproteinázové inhibitory, kterými jsou deriváty přírodních aminokyselin obecného vzorce:



Mezinárodní publikace PCT WO 95/09841 popisuje sloučeniny, kterými jsou deriváty kyseliny hydroxamové jako inhibitory produkce cytokinu.

Evropská patentová přihláška č. 574,758 A1 popisuje deriváty kyseliny hydroxamové jako kolagenázové inhibitory obecného vzorce:



GB 2 268 934 A a WO 94/24140 nárokují hydroxamátové inhibitory MMP jako inhibitory TNF produkce.

Sloučeniny podle vynálezu působí jako inhibitory MMP, zejména aggregázy a TNF-C, čímž zabraňují ztrátě a destrukci chrupavky a představují prevenci před zánětlivými poruchami zahrnujícími TNF. Kyselina hydroxamová, kyselina karboxylová a jejich deriváty jsou cyklickými sloučeninami, které tedy nemají peptidovou povahu, což představuje značnou výhodu oproti existujícím inhibitorům, protože vykazují vynikající farmako-kinetické parametry. Předností těchto molekul jsou rozpustnost ve vodě a orální biologická dostupnost.

Podstata vynálezu

Vynález poskytuje nové hydroxamové kyseliny a karboxylové kyseliny a jejich deriváty obecného vzorce I (viz níže), které jsou použitelné jako inhibitory metaloproteináz, například aggreganázy a TNF-C. Vynález rovněž zahrnuje farmaceutické kompozice, obsahující sloučeniny obecného vzorce I a způsoby použití těchto sloučenin při léčení artritidy a dalších výše popsanych zánětlivých chorob u pacienta.

Předmětem vynálezu jsou rovněž farmaceutické sady, obsahující jednu nebo více nádobek s farmaceutickými dávkovými jednotkami, které obsahují sloučeninu obecného vzorce I pro léčení artritidy a dalších výše popsanych zánětlivých chorob.

Sloučeniny podle vynálezu mohou obsahovat asymetrická centra. Sloučeniny podle vynálezu obsahující asymetricky substituované atomy mohou být izolovány v opticky aktivních nebo racemických formách. Způsoby přípravy opticky aktivních forem jsou dobře známe v tomto oboru. Jedná se například o optické štěpení racemických forem nebo o přímou syntézu z opticky aktivních výchozích látek. Popsané sloučeniny mohou také zahrnovat mnoho geometrických izomerů vznikajících na olefinické vazbě, C=N dvojně vazbě apod., a všechny takto odvozené stabilní izomery spadají do rozsahu tohoto vynálezu. Jsou popsány cis a trans optické izomery sloučenin podle předkládaného vynálezu a mohou být izolovány jako směsi izomerů nebo jako oddělené izomerní formy. Pokud není ve vzorci či názvu specificky vyznačena stereochemie, rozumí se, že pod tento vzorec či název spadají všechny chirální, diastereomerické nebo racemické formy a všechny geometrické izomerické formy popsané struktury.

Pod označením "substituovaný" se zde rozumí, že kterýkoliv alespoň jeden z atomů vodíku připojených k takto označenému substituentu je nahrazen substituentem zvoleným z definičního souboru, za předpokladu, že se nepřekročí normální mocenství takového atomu a že má výsledná substituce za následek vznik stabilní sloučeniny. Pokud je takovým substituentem ketoskupina (tj. skupina =O), potom jsou takovým způsobem nahrazeny dva atomy vodíku.

Jestliže se některá z proměnných (například R^b) vyskytuje vícekrát než jednou v jakékoliv složce nebo vzorci sloučeniny, její definice je v každém výskytu nezávislá. Tak například, jestliže se uvádí, že skupina je substituována 0 až 2 R^6 , pak uvedená skupina může být případně substituována až dvěma skupinami R^6 , přičemž R^6 je v každém výskytu nezávisle vybrán z definice R^6 . Jsou rovněž přípustné kombinace substituentů a/nebo proměnných, ovšem za předpokladu, že vedou ke stabilním sloučeninám.

Pokud vazba k substituentu křížuje vazbu spojující dva atomy v kruhu, potom může být substituent vázán ke kterémukoliv atomu kruhu. Pokud se neuvádí u substituentu atom, kterým je vázán ke zbytku sloučeniny daného vzorce, potom může být takový substituent vázán kterýmkoliv atomem substituentu. Jsou rovněž přípustné kombinace substituentů a/nebo proměnných, ovšem za předpokladu, že vedou ke stabilním sloučeninám.

Pod pojmem "H" se rozumí také substituce s deuteriem nebo tritiem. Pokud "H" není indikován, ale je částí vazby, pak se tím rozumí, že zahrnuje rovněž substituce s deuteriem nebo tritiem.

Pod pojmem " C_{1-10} alkyl" nebo " C_{1-10} alkylen" se rozumí nasycené alifatické uhlovodíkové skupiny s řetězcem přímým a rozvětveným, které obsahují uvedený počet atomů uhlíku

a příklady takových skupin zahrnují, nikoliv však s omezením, methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sek.butyl, terc.butyl, pentyl a hexyl;

Pod pojmem "alkenyl" nebo "alkenylen" se označují uhlovodíkové řetězce s přímou nebo rozvětvenou konfigurací a které mají jednu nebo více nenasycených vazeb uhlík-uhlík a které se mohou vyskytovat v kterémkoliv stabilním místě celého řetězce. Jako příklady se uvádějí ethenyl, propenyl apod.

Pod pojmem "alkinyl" nebo "alkinylen" se označují uhlovodíkové řetězce s přímou nebo rozvětvenou konfigurací a které mají jednu nebo více trojných vazeb uhlík-uhlík a které se mohou vyskytovat v kterémkoliv stabilním místě celého řetězce. Jako příklady se uvádějí ethinyl, propinyl apod.

Pod pojmem "aryl" nebo "aromatický zbytek" se označují fenyl nebo naftyl a rovněž se obecně vztahuje k "heterocyklu" nebo "heteroarylu" nebo k "heterocyklickým sloučeninám"

Pod pojmem "alkylaryl" se označuje arylová skupina připojená přes alkylový můstek.

Pod pojmem "halogen" jak se ho používá v tomto textu, se rozumí fluor, chlor, brom a jod a pojmu "protiion" se používá pro označení malého, negativně nabitého zbytku, jako je chlorid, bromid, hydroxid, acetát, sulfát apod.

Pod pojmem "karbocykl" nebo "karbocyklický zbytek" jak se zde používá se rozumí kterýkoliv stabilní 3- až 7-členný monocyklický nebo nebo 7- až 13-členný bicyklický nebo tricyklický kruh, přičemž kterýkoliv z nich může být nasycený, částečně nenasycený nebo aromatický. Příklady zahrnují, nikoliv však s omezením, cyklopropyl, cyklobutyl,

cyklopentyl, cyklohexyl, cykloheptyl, adamantyl, cyklooktyl;
[3.3.0]bicyklooktan, [4.3.0]bicyklononan,
[4.4.0]bicyklodekan (dekalin), [2.2.2]bicyklooktan,
fluorfenyl, fenyl, naftyl, indanyl, adamantyl nebo
tetrahydronaftyl (tetralin).

Pod pojmem "heterocyklus" nebo "heterocyklický systém" se rozumí stabilní 5- až 7-členný monocyklický nebo bicyklický, nebo 7- až 14-členný bicyklický kruh, který je nasycený, částečně nenasycený nebo aromatický a obsahuje atomy uhlíku a 1 až 4 heteroatomy nezávisle vybrané ze souboru zahrnujícího dusík, kyslík a síru. Do rozsahu tohoto pojmu také spadají bicyklické skupiny, v nichž je některý z výše definovaných kruhů přikondenzován k benzenovému kruhu. V takových skupinách mohou být dusíkové a sírové heteroatomy oxidovány. Heterocyklický kruh může být připojen ke své pendantní skupině na kterémkoliv heteroatomu nebo atomu uhlíku, který umožní vznik stabilní struktury. Výše uvedené heterocyklické kruhy mohou být substituovány na uhlíkovém nebo dusíkovém atomu, za předpokladu, že vzniknou stabilní sloučeniny. Atom dusíku může být případně kvarternizován. Je výhodné, když celkový počet atomů síry a kyslíku je větší než 1 a když jsou tyto heteroatomy navzájem nesousední.

Pod pojmem "aromatický heterocyklický systém" se rozumí stabilní 5- až 7-členný monocyklický nebo bicyklický, nebo 7- až 14-členný bicyklický kruh, který je nasycený, částečně nenasycený nebo aromatický a obsahuje atomy uhlíku a 1 až 4 heteroatomy nezávisle vybrané ze souboru zahrnujícího dusík, kyslík a síru. Je výhodné, když celkový počet atomů S a O v aromatickém heterocyklu není větší než 1.

Příklady heterocyklů zahrnují, nikoliv však s omezením, 1H-indazol, 2-pyrrolidonyl, 2H,6H-1,5,2-dithiazinyl, 2H-pyrrolyl, 3H-indolyl, 4-piperidonyl, 4aH-karbazol,

4H-chinoliziny, 6H-1,2,5-thiadiaziny, akridiny, azociny, benzimidazoly, benzofurany, benzothiofurany, benzothiofeny, benzoxazoly, benzthiazoly, benztriazoly, benztetrazoly, benzisoxazoly, benzisothiazoly, benzimidazolony, karbazoly, 4aH-karbazoly, b-karboliny, chromany, chromeny, cinnoliny, dekahydrochinoliny, 2H,6H-1,5,2-dithiaziny, dihydrofuro[2,3-b]tetrahydrofuran, furany, furazany, imidazolidiny, imidazoliny, imidazoly, 1H-indazoly, indoleny, indoliny, indoliziny, indoly, isobenzofurany, isochromany, isoindazoly, isoindoliny, isoindoly, isochinoliny, isothiazoly, isoxazoly, morfoliny, naftyridiny, oktahydroisochinoliny, oxadiazoly, 1,2,3-oxadiazoly, 1,2,4-oxadiazoly, 1,2,5-oxadiazoly, 1,3,4-oxadiazoly, oxazolidiny, oxazoly, oxazolidiny, pyrimidiny, fenantridiny, fenantroliny, fenarsaziny, fenaziny, fenothiaziny, fenoxathiiny, fenoxaziny, ftalaziny, piperaziny, piperidiny, pteridiny, piperidony, 4-piperidony, puriny, pyrany, pyraziny, pyrazolidiny, pyrazoliny, pyrazoly, pyridaziny, pyridooxazol, pyridoimidazol, pyridothiazol, pyridiny, pyridyl, pyrimidiny, pyrrolidiny, pyrroliny, pyrroly, chinazoliny, chinoliny, 4H-chinoliziny, chinoxaliny, chinuklidiny, karboliny, tetrahydrofurany, tetrahydroisochinoliny, tetrahydrochinoliny, 6H-1,2,5-thiadiaziny, 1,2,3-thiadiazoly, 1,2,4-thiadiazoly, 1,2,5-thiadiazoly, 1,3,4-thiadiazoly, thiantreny, thiazoly, thieny, thienothiazoly, thienooxazoly, thienoimidazoly, thiofeny, triaziny, 1,2,3-triazoly, 1,2,4-triazoly, 1,2,5-triazoly, 1,3,4-triazoly a xanteny. Výhodné heterocykly zahrnují, nikoliv však s omezením, pyridiny, furany, thieny, pyrroly, pyrazoly, imidazoly, indoly, benzimidazoly, 1H-indazoly, oxazolidiny, benzotriazoly, benzisoxazoly, oxindoly, benzoxazoliny nebo isatinoy. Jsou rovněž zahrnuty kondenzované kruhové a spiro sloučeniny obsahující například shora uvedené heterocykly.

Výraz "aminokyselina", jak se zde používá, označuje organickou sloučeninu obsahující jak bárickou aminoskupinu, tak kyselinovou karboxylovou skupinu. Tento výraz zahrnuje také přírodní aminokyseliny (například L-amino kyseliny), modifikované a neobvyklé aminokyseliny (například D-amino kyseliny) a stejně tak aminokyseliny, o nichž je známo, že se biologicky vyskytují ve volné nebo kombinované formě, ale zpravidla se nevyskytují v proteinech. Do rozsahu tohoto výrazu rovněž spadají modifikované a neobvyklé kyseliny, které například popsal Roberts a Vellacio v publikaci The Peptides, 5: 342 až 429, (1983). Přírodní v proteinech se vyskytují aminokyseliny zahrnují, nikoliv však s omezením, alanin, arginin, asparagin, kyselinu aspartovou, cystein, kyselinu glutamovou, glutamin, glycin, histidin, isoleucin, leucin, lysin, methionin, fenylalanin, serin, threonin, tyrosin, triptofan, prolin a valin. Přírodní neproteinové aminokyseliny zahrnují, nikoliv však s omezením, kyselinu argininjantarovou, citrullin, cystein sulfinovou kyselinu, 3,4-dihydroxyfenylalanin, homocystein, homoserin, ornitin, 3-monojodtyrosin, 3,5-dijodtyrosin, 3,5,5'-trijodthyronin a 3,3',5,5'-tetrajodthyronin. Modifikované nebo neobvyklé aminokyseliny, které lze použít v rámci vynálezu zahrnují neomezujícím způsobem D-aminokyseliny, hydroxylysin, 4-hydroxyprolin, N-Cbz-chráněnou aminokyselinu, kyselinu 2,4-diaminobutyrovou, homoarginin, norleucin, kyselinu N-methylaminobutyrovou, naftylalanin, fenylglycin, β -fenylprolin, terc.-leucin, 4-aminocyklohexylalanin, N-methyl-norleucin, 3,4-dehydroprolin, N,N-dimethylaminoglycin, N-methylaminoglycin, 4-aminopiperidin-4-karboxylovou kyselinu, 6-aminokapronovou kyselinu, trans-4-(aminomethyl)-cyklohexankarboxylovou kyselinu, 2-, 3-, a 4-(aminomethyl)-benzoovou kyselinu, 1-aminocyklopentankarboxylovou kyselinu, 1-aminocyklopropankarboxylovou kyselinu, a 2-benzyl-5-aminopentanovou kyselinu.

Pod pojmem "farmaceuticky přijatelný" se zde rozumí sloučeniny, materiály, prostředky a/nebo dávkové formy, které jsou, v rozsahu zdraví z lékařského hlediska, vhodné pro použití s tkáněmi lidských bytostí a zvířat bez nadměrné toxicity, podráždění, alergické odezvy nebo dalších problémů nebo komplikací za zachování přiměřeného poměru užitek/riziko.

Pod pojmem "farmaceuticky přijatelné soli", jak se ho používá v tomto textu, se rozumějí deriváty sloučenin podle vynálezu, které jsou modifikovány vytvořením jejich solí s kyselinami nebo bázemi. Příklady farmaceuticky přijatelných solí zahrnují, nikoliv však s omezením, minerální nebo organické soli bázeických zbytků, jako jsou aminy; nebo alkalické či organické soli kyselých zbytků jako jsou soli karboxylových kyselin apod. Farmaceuticky přijatelné soli zahrnují konvenční netoxické soli kvarterních amoniových solí mateřských sloučenin, například z netoxických anorganických nebo organických kyselin. Například takové konvenční soli zahrnují takové deriváty anorganických kyselin, jako je kyselina chlorovodíková, bromovodíková, sírová, sulfamová, fosforečná, dusičná apod.; a takové soli připravené z organických kyselin, jako je kyselina octová, propionová, jantarová, glykolová, stearová, mléčná, jablečná, vinná, citronová, askorbová, pamoová, maleinová, hydroxymaleinová, fenylactová, glutamová, benzoová, salicylová, sulfanilová, 2-acetoxybenzoová, fumarová, toluensulfonová, methansulfonová, ethansulfonová, šťavelová, isethionová apod.

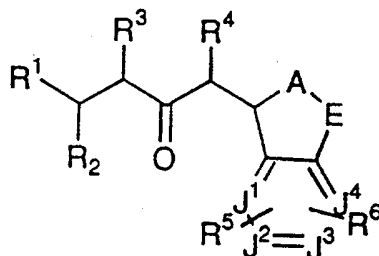
Farmaceuticky vhodné soli podle vynálezu je možné vyrábět syntézou z mateřské sloučeniny, která obsahuje bázeický nebo kyselý zbytek, konvenčními chemickými postupy. Obecně se soli připravují tak, že se volná báze nebo kyselina nechá reagovat se stechiometrickým množstvím nebo nadbytkem požadované solitvorné báze nebo kyseliny ve vodě nebo v organickém

rozpouštědly nebo v jejich směsích. Obecně, je vhodné nevodné prostředí, jako je ether, ethylacetát, ethanol, isopropanol nebo acetonitril. Seznam vhodných solí je uveden v *Remington's Pharmaceutical Sciences*, 17. vydání, Mack Publishing Company, Easton, PA, 1985, str. 1418, zde uváděné jako odkaz.

Pod označením "proléčiva" nebo "deriváty proléčiv" se rozumí struktury vzniklé kovalentním připojením účinného mateřského léčiva obecného vzorce I k nosiči, z něhož je mateřské léčivo uvolněno in vivo, když je proléčivo podáno savčímu subjektu. Proléčiva sloučenin obecného vzorce I se připravují modifikací funkčních skupin přítomných v těchto léčivech, aby ke štěpení takových modifikací, za vzniku mateřské sloučeniny, došlo při rutinní manipulaci nebo in vivo. Proléčiva zahrnují sloučeniny obecného vzorce I, v nichž je hydroxyskupina, aminoskupina nebo sulfhydrylová skupina připojená k jiné skupině, která se po podání savčímu subjektu znovu odštěpí za vzniku volné hydroxyskupiny, volné aminoskupiny nebo volné sulfhydrylové skupiny. Jako neomezující příklady proléčiv se uvádějí acetáty, formiáty a benzoáty vytvořené na alkoholické nebo aminové funkční skupině sloučeniny obecného vzorce I apod.

Pod pojmem "stabilní sloučenina" nebo "stabilní struktura" se rozumí sloučenina, která je dostatečně robustní, aby zůstala zachována při izolaci na užitečný stupeň čistoty z reakční směsi a formulaci do účinného terapeutického činidla.

[1] Předmětem vynálezu je sloučenina obecného vzorce I



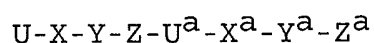
Obecný vzorec I

nebo její farmaceuticky přijatelná sůl nebo její stereoisomer, kde

R^1 se zvolí z:

-CO₂H, -C(O)NHOH, -C(O)NHOR⁷, -SH, -CH₂CO₂R⁷, -COR⁷,
 -N(OH)COR⁷, -SN₂H₂R⁷, -SONHR⁷, -CH₂CO₂H, -PO(OH)₂,
 -PO(OH)NHR⁷, -CH₂SH, -C(O)NHOR⁷, -CO₂R⁷
 a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
 NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
 S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

kde:

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenů, C₂₋₁₀ alkenylenů,
 C₂₋₁₀ alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku

substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karboxylového zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

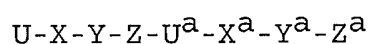
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,

Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, NR^aS(O)₂R^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R³ se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

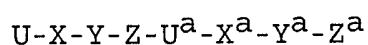
R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:

vodíku, (C_1-C_5) alkyly, (C_1-C_5) alkyl-arylu,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,

$\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$,
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$,
 $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
 fenylu nebo benzylu;

$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
 fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $\text{R}^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému

jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $NR^aS(O)_2R^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_{1-8} alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_{1-8} alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,
O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
amino,
 C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,
hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkylu,
 C_1-C_8 alkylarylu,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,
příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

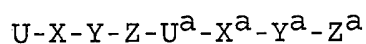
[2] Předmětem vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce I

kde

R^1 se zvolí z:

$-CO_2H$, $-C(O)NHOH$, $-C(O)NHR^7$, $-SH$, $-CH_2CO_2R^7$, $-COR^7$,
 $-N(OH)COR^7$, $-SN_2H_2R^7$, $-SONHR^7$, $-CH_2CO_2H$, $-PO(OH)_2$,
 $-PO(OH)NHR^7$, $-CH_2SH$, $-C(O)NHR^7$, $-CO_2R^7$
a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,
 $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

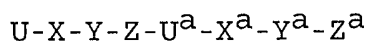
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkyleny, C_{2-10} alkenyleny, C_{2-10} alkinyleny;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

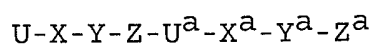
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:
vodíku,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,
 C_1-C_8 alkylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_1-8 alkenylu,
 C_1-C_8 alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího
 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,
 O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
 amino,
 C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,
 hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušený NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkylu,
 C_1-C_8 alkylarylu,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

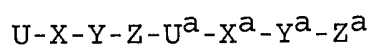
CH nebo N,
 přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

[3] Předmět vynálezu zahrnuje výhodně sloučeniny obecného vzorce I kde

R^1 se zvolí z:

$-CO_2H$, $-C(O)NHOH$, $-C(O)NHO R^7$, $-SH$, $-CH_2CO_2R^7$
 a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) , C(O)NR^a ,
 $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$, $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$,
 S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) ,
 C(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$,
 $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$, S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

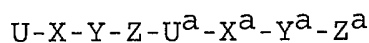
$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0

až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$,
 $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
N, O a S;

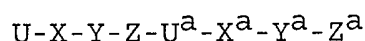
R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a ,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a ,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 ,
 CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému

obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:
vodíku,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a ,
 NR^a C(O), OC(O)O, OC(O) NR^a , NR^a C(O)O, NR^a C(O) NR^a ,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O) NR^a , NR^a C(O), OC(O)O, OC(O) NR^a , NR^a C(O)O,
 NR^a C(O) NR^a , $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO , O , S(O)_m a NR^{10} ,
 m je 0 až 2,
 n je 0 až 2;

s tím, že když W je O , S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H ,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkenylu,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylarylů substituovaného 0 až 5 R^b ,
 $\text{C}_3\text{-C}_{13}$ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího
1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N ,
 O , a S , substituovaného 0 až 5 R^b ;
amino,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkyl- NR^{10} ,
hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušovaný NR^{10} , O , S(O)_m .

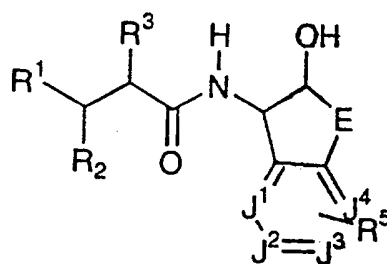
R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylu,
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylarylů,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N ,
příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N .

[4] Předmět vynálezu zahrnuje výhodně sloučeniny obecného vzorce II



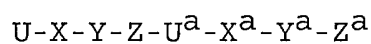
Obecný vzorec II

nebo jejich farmaceuticky přijatelnou sůl nebo stereoizomer,
kde

R^1 se zvolí z:

$-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^7$, $-\text{SH}$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^7$
a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0

až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O) NR^a , NR^a C(O), OC(O)O, OC(O) NR^a , NR^a C(O)O,
 NR^a C(O) NR^a , S(O)_p, S(O)_p NR^a , NR^a S(O)_p a NR^a SO₂ NR^a ;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenů, C₂₋₁₀ alkenylenů,
C₂₋₁₀ alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly,
fenylů nebo benzylů;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly,
fenylů nebo benzylů;

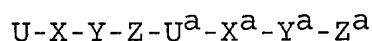
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkyly, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, $NR^aR^{a'}$, C(O) R^a , C(O)OR^a,
C(O) $NR^aR^{a'}$, S(O)₂ $NR^aR^{a'}$, S(O)_p R^a , CF₃ a CF₂CF₃;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkyly, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, $NR^aR^{a'}$, C(O) R^a , C(O)OR^a,
C(O) $NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, S(O)₂ $NR^aR^{a'}$, S(O)_p R^a , CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému

obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a ,
 $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy

vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

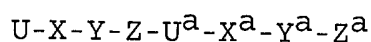
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,

C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $NR^aS(O)_2R^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_{1-8} alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_{1-8} alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;

amino,

C_{1-8} alkyl- NR^{10} ,

hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkyly,
 C_1-C_8 alkylarylu,

J^1, J^2, J^3, J^4 se nezávisle zvolí z:

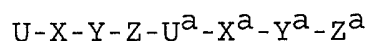
CH nebo N,
 přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

[5] Předmět vynálezu zahrnuje výhodně sloučeniny obecného vzorce II kde:

R^1 se zvolí z:

$-C(O)NHOH$,
 a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,
 $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$,
 $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
fenylu nebo benzylu;

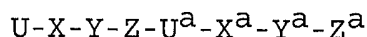
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 ,
 CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,

který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , NR^a C(O), OC(O)O, OC(O) NR^a , NR^a C(O)O, NR^a C(O) NR^a , $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , NR^a C(O), OC(O)O, OC(O) NR^a , NR^a C(O)O, NR^a C(O) NR^a , $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0

až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

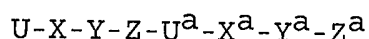
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) , C(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$, $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$, S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $\text{R}^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,

Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^a-, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^a-, S(O)₂NR^aR^a-, S(O)_pR^a, CF₃ a CF₂CF₃;

R^c, při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkyly, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^a-, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^a-, NR^aS(O)₂R^a-, S(O)₂NR^aR^a-, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R⁷ se zvolí z: C₁₋₁₀ alkyly, alkylarylu, a obvyklých
prekurzorových derivátů

E je (CR⁸R⁹)_m-W-(CR⁸R⁹)_n,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH₂, CO, O, S(O)_m a NR¹⁰,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR¹⁰, potom m nesmí být 0;

R⁸ a R⁹ se nezávisle zvolí z:

H,

C₁-C₈ alkyly substituovaného 0 až 5 R^b,

C₁₋₈ alkenylu,

C₁-C₈ alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b,

C₃-C₁₃ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b;

amino,

C₁-C₈ alkyl-NR¹⁰,

hydroxylu,

R⁸ a R⁹ také mohou tvořit kruh přerušný NR¹⁰, O, S(O)_m.

R¹⁰ se zvolí z:

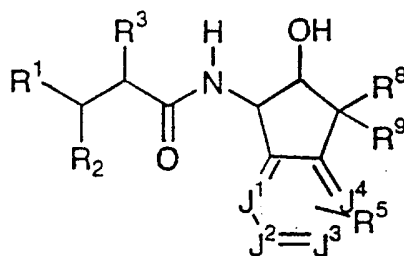
vodíku,
C₁-C₈ alkylu,
C₁-C₈ alkylarylu,

J¹, J², J³, J⁴ se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,

příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

[6] Výhodnější sloučeniny podle předkládaného vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce III



Obecný vzorec III

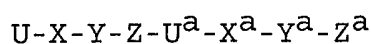
nebo jejich farmaceuticky přijatelná sůl nebo stereoizomer kde:

R¹ se zvolí z:

-C(O)NHOH,

a z běžných derivátů proléčiv;

R² se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu, C₂₋₁₀ alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a, NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a, S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu, C₂₋₁₀ alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c;

R^a, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly, fenylu nebo benzylu;

R^{a'}, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly, fenylu nebo benzylu;

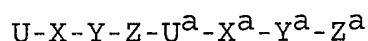
alternativně, R^a a R^{a'} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující

N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkyleny, C_{2-10} alkenyleny, C_{2-10} alkinyleny;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,

$\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů, C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

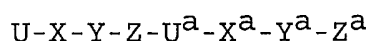
$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $\text{R}^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a'}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^{a'}$, $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,

fenylu nebo benzylu;

R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a R^{a-} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $NR^aS(O)_2R^{a-}$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_1-C_8 alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_1-C_8 alkylarylů substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;

amino,

C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,

hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušovaný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

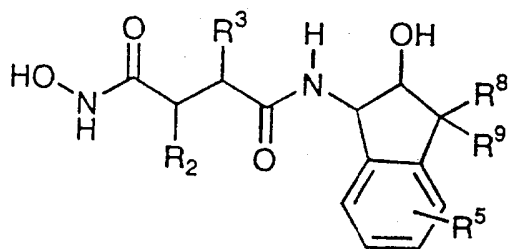
R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkylu,
 C_1-C_8 alkylarylu,

J^1, J^2, J^3, J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,
 přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

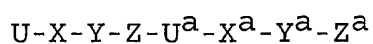
[7] Výhodnější sloučeniny podle předkládaného vynálezu jsou sloučeniny obecného vzorce IV



Obecný vzorec IV

nebo jejich farmaceuticky přijatelná sůl nebo stereoisomer kde:

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) , C(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$, $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$, S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

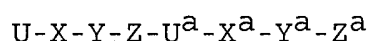
alternativně, R^a a $\text{R}^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,

Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃ a CF₂CF₃;

R^C, při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkyly, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, NR^aS(O)₂R^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R³ se zvolí ze vzorce:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O),
C(O)NR^a, NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O,
NR^aC(O)NR^a, S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,

C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

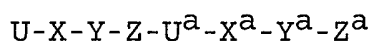
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,

fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,
 C_1-C_8 alkylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_{1-8} alkenylu,
 C_1-C_8 alkylarylů substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
amino,
 C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,
hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušovaný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkylu,

C₁-C₈ alkylarylu.

[8] Nejvýhodnější sloučeniny podle předkládaného vynálezu jsou sloučeniny vybrané ze skupiny, která obsahuje:

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-5-(hydroxykarbonyl)-pentanamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-methylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-propylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-hexyl-3(S)-propylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-hydroxy-fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-methoxy-fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-hydroxyfenyl)methyl]-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-fenyl-propyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyloxy)-fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-

18.02.00

- (benzyloxy) -fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4 -
- (fluorfenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3, 4 -
- (methylenedioxyfenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (methoxyfenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (3 -
- trifluormethylfenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
- terc.butylaminosulfonylfenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
- methoxyfenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 -
- (fenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [(3 -
- hydroxy-4-methoxyfenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3 - (3 -
- thiofen) isoxazolin] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
- chlorfenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -

-benzofuran) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-methylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3,4-(methylenedioxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-tetrazolfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-methylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-(aminofenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyloxykarbonyl) amino] fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-hydroxymethylen) fenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4,5-trimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,5-dichlorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-trifluormethylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-

-isopropylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dichlorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-chlor-4-fluorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(p-toluensulfonylamino) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4-methylenedioxyfenyl) fenyl]methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-methoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-fluorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(fluorfenyl)methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxyfenyl)methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-nitrofenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-(methylsulfonylamino)-fenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (3-trimethylsilylpropyl) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (3-trimethylsilylpropyl) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropionamido) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (ethyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (isobutyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (propionamido) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (1-methylcyklopropankarboxamido-1-
-yl) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (methylsulfonylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - aminobutandiamid;

18.02.00

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-(methylsulfonylamino)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-(5-hydroxykarbonyl)pentanamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-methylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-propylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-hexyl-3(S)-propylbutandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-hydroxyphenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-methoxyphenyl)methyl]butandiamid;

N1-[1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-(hydroxyphenyl)methyl]butandiamid

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-phenylpropyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyloxy)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-(benzyloxy)phenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (hydroxyfenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (fluorfenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3, 4-
- (methyendioxyfenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (methoxyfenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-trifluormethylfenyl) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-terc.butylaminosulfonylfenyl) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-methoxyfenyl) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (fenyl) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [(3-
-hydroxy-4-methoxyfenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3- (3-
-thiofen) isoxazolin] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-chlorfenyl) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-benzofuran) fenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-methylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3, 4-
- (methyendioxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-tetrazolfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
-fenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
-methylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
-aminofenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (benzyloxykarbonyl) amino] fenyl) methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-hydroxymethylen) fenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (3, 4, 5-trimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (2, 4, -dimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (3, 5-dichlorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-trifluormethylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

18.02.00

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-isopropylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dichlorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-chlor-4-fluorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(p-toluensulfonylamino)fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4-methylenedioxyfenyl)fenyl]methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-methoxyfenyl)fenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(fluorfenyl)methyl]-3-(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxyfenyl)methyl]-3-(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-nitrofenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-methylsulfonylamino)fenyl]fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) -trimethylsilylpropyl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropionamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (ethyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (isobutyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (propionamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-methylcyklopropan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (methylsulonylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) -aminobutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklobutan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-hydroxymethylisobutanamid)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-hydroxylcyklopropan karboxamido-1-yl) -

butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-fenylcyklopropan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-kyanocyklopropan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-fenylcyklopentan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-methylcyklohexan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-indol karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-furan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-chinolin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3,4,5-trimethoxybenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methyl-3-aminobenzen karboxamido-1-yl)-

butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methyl-6-aminobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-pyridin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-(2,4-dichlorfenyl)cyklopropan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-(4-chlorfenyl)cyklopropan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-methylsulfonyl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methylsulfonyl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-kyanobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(6-chinolin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-ethyl,3-methylpyrazol 5-karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-morfolinobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-chlor-4-methylsulfonylbenzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-(imidazol-1-yl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-thiofen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-terc.butyl,3-methylpyrazol 5-karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-aminomethyl benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-hydroxylisobutanamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklopropan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklopentan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-cyklopentyl acetamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklohexan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-(4-N-Boc-piperaziny-1-yl)benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-piperaziny-1-yl)benzenkarboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-fluor-6-chlorbenzenkarboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-aminocyklohexan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methylthioacetamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methoxyacetamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-allylcyklopentan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-n-propylcyklopentan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-allylcyklopropan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (8-chinolinsulfonamido)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (4-nitrobenzensulfonamido)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,4-dimethyl-2-chlorpyrazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,5-dimethyl-isooxazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-methyl-imidazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (benzensulfonamido)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,4-dimethyl pyrazol 3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-methylsulfonyl benzen sulfonamido-1-yl) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklohexylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (isopropylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4 (2-trifluor-methylfenyl) fenylmethyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (cyklopentylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (cyklopropylmethyl) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (benzylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (2-furanmethylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-4-methylfenyl) methyl] -3 (S) - (3-kyanofenylmethylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (2-pentylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (cyklopropylmethylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (2-thiofenmethylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (2-methylpropylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl) methyl] -3 (S) - (1-methylcyklopropan karboxamido-1-yl) -

butandiamid;

Předkládaný vynález také poskytuje léčbu zánětlivé nemoci u savců, zahrnující podání uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny obecného vzorce I jak je popsána dále.

Předkládaný vynález také poskytuje způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggregací u savců, zahrnující podání uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny obecného vzorce I jak je zde popsána.

Předkládaný vynález také poskytuje způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invaze nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárního glaukomu, násobné sklerózy nebo psoriázy u savců zahrnující podání uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny obecného vzorce I jak je zde popsána.

Předkládaný vynález také poskytuje způsob léčby stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvy, akutní infekce, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoc nebo infekce HIV u savců zahrnující podání uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny obecného vzorce I jak je zde popsána.

V následujícím popisu znamená (-) bod připojení.

Syntézy

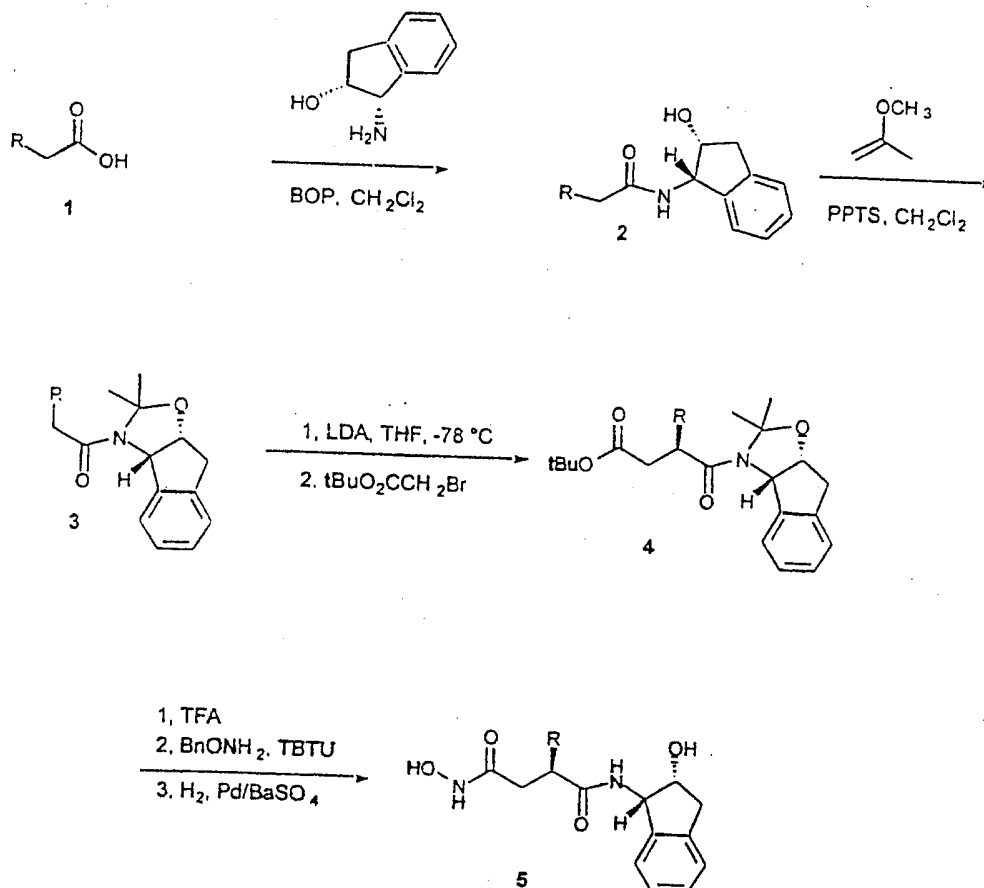
Sloučeniny podle předkládaného vynálezu se mohou

připravit řadou různých způsobů, které jsou známy odborníkům v oboru organické syntézy. Sloučeniny podle vynálezu je možno syntetizovat dále popsánymi způsoby a syntetickými postupy známými z oboru organické chemie. Také lze použít různých variací dále uvedených či popsáných postupů. Výhodné postupy zahrnují, nikoliv však s omezením, ty, které jsou popsány dále.

Nové sloučeniny podle vynálezu se mohou připravit za použití reakcí a technik této sekce. Reakce se provádějí ve vhodném rozpouštědle vůči reakčním složkám a použitým materiálům a vhodné pro účinnou transformaci. Rovněž v popise postupů přípravy popsáných dále je třeba vzít v úvahu, že všechny navržené reakční podmínky, zahrnující výběr rozpouštědel, reakční teplotu, trvání experimentu a pracovní postupy jsou vybrány tak, aby byly podmínky standardní pro reakci, což může být snadno určeno odborníkem. Je třeba brát v úvahu, aby funkční skupiny přítomné v molekule byly kompatibilní s reakčními složkami a navrženými reakcemi. Taková omezení substituentů, které jsou kompatibilní s reakčními podmínkami bude odborníkům zřejmé a někdy bude nutné použít alternativní metody.

Metodami popsánymi ve schématu 1 se připraví řada sloučenin vzorce 5. Kopulace karboxylové kyseliny 1 s cis-(1S,2R-(-)-1-amino-2-indanol poskytuje amid 2. Hydroxylová skupina 2 se chrání jako acetonid 3 a následuje alkylace s terc.butyl 2-bromacetátem a získá se žádaný diastereomer 4. Odstraněním terc.butylové skupiny 4 s TFA v methylenchloridu následované kopulací s O-benzylhydroxylaminem a hydrogenací se získá cílová molekula 5.

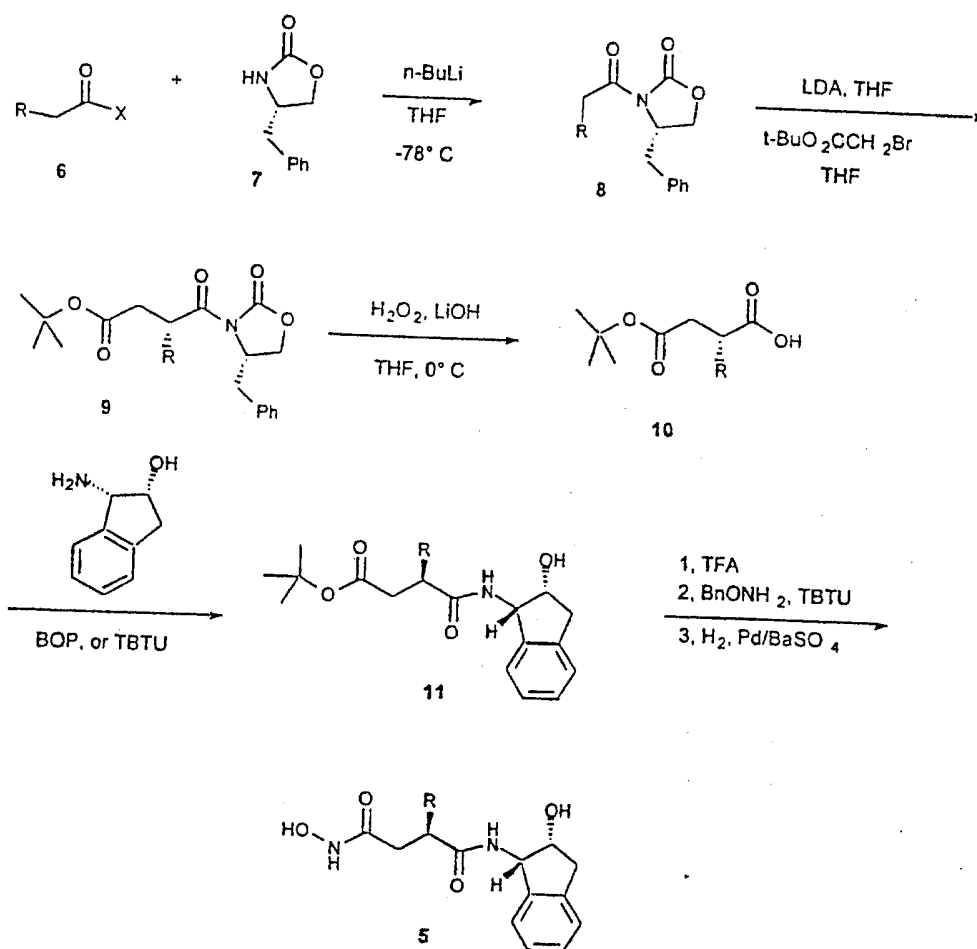
Schéma 1



Sloučeniny vzorce 5 se také mohou připravit metodami popsanými ve schématu 2. 2-substituovaná kyselina jantarová 10 se může připravit za použití standardní Evansovy chemie. Kyselina 6 ($\text{X} = \text{Cl}$) se převede na její oxazilidinonový derivát 8 za použití standardní chemie. Asymetrická alkylace následovaná hydrolýzou za použití $\text{H}_2\text{O}_2/\text{LiOH}$ poskytuje žádanou kyselinu 10. Monochráněná kyselina jantarová se kopuluje na (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanol za použití standardního BOP nebo ostatních peptidových kopulačních složek jako DCC, EDAC, TBTU. Meziprodukt 11 se potom může snadno převést na

cílovou sloučeninu 5 použitím podobných postupů jak se používají při syntéze cílové sloučeniny 5 jak je popsáno ve schématu 1.

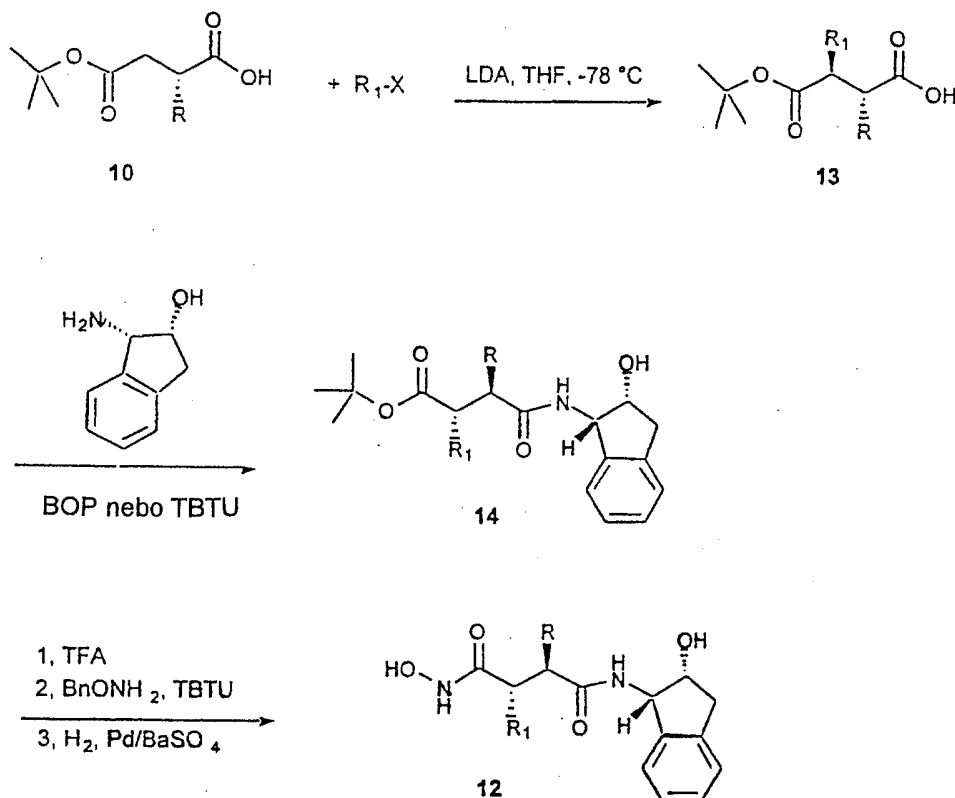
Schéma 2



Sloučeniny vzorce 12 se připraví způsobem popsaným ve schématu 3. Dianionovou reakcí meziproductu 10 s organickými halidy nebo trifláty se získá 2,3-disubstituovaný sukcinát 13. Kyselina 13 se kopuluje s *cis*-(1*S*, 2*R*)-(-)-1-amino-2-indanolem. Následuje podobný postup, který se použil při

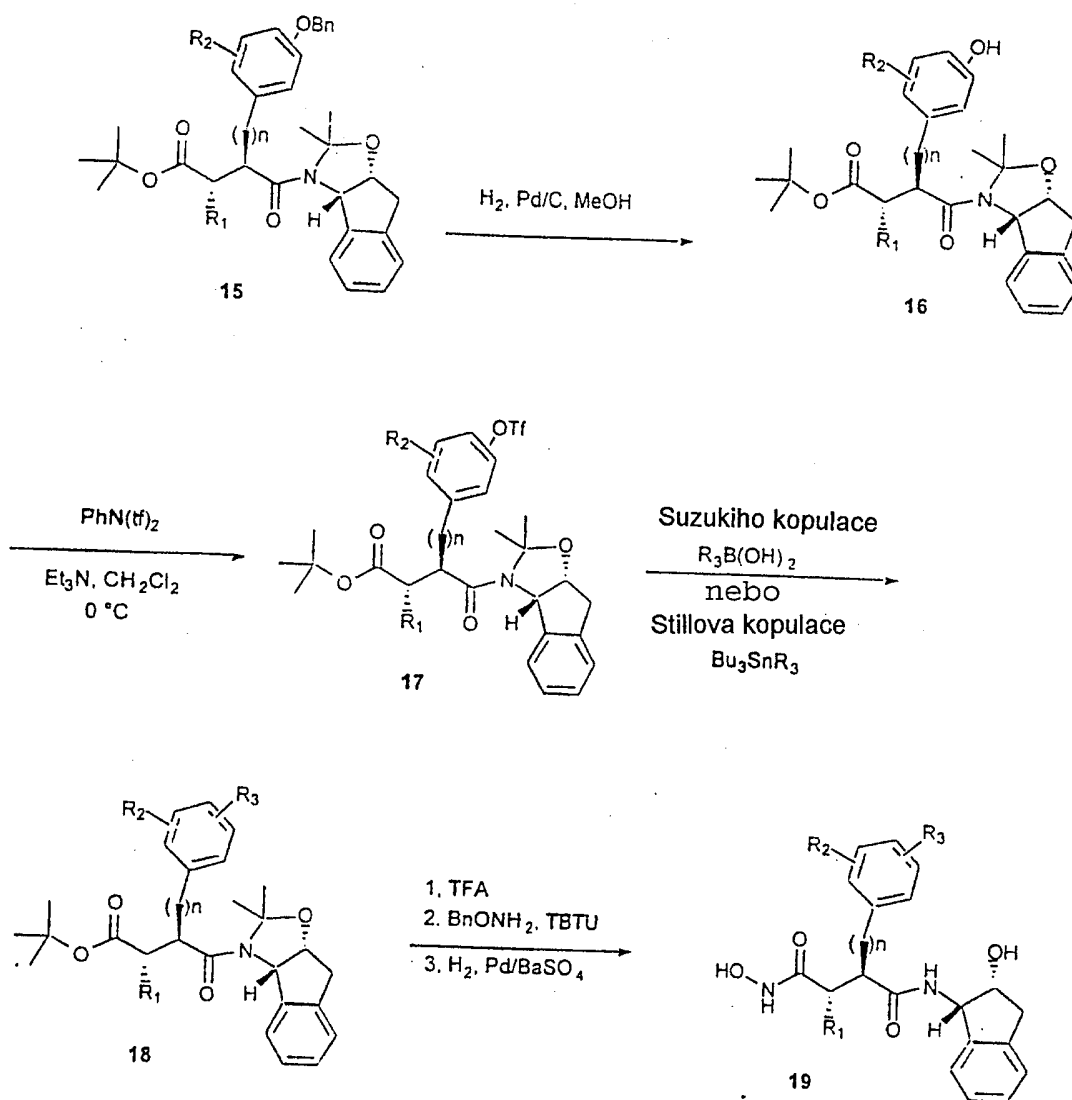
přípravě cílové sloučeniny 5, jak je popsáno ve schématu 1 a připraví se snadno sloučeniny vzorce 12.

Schéma 3



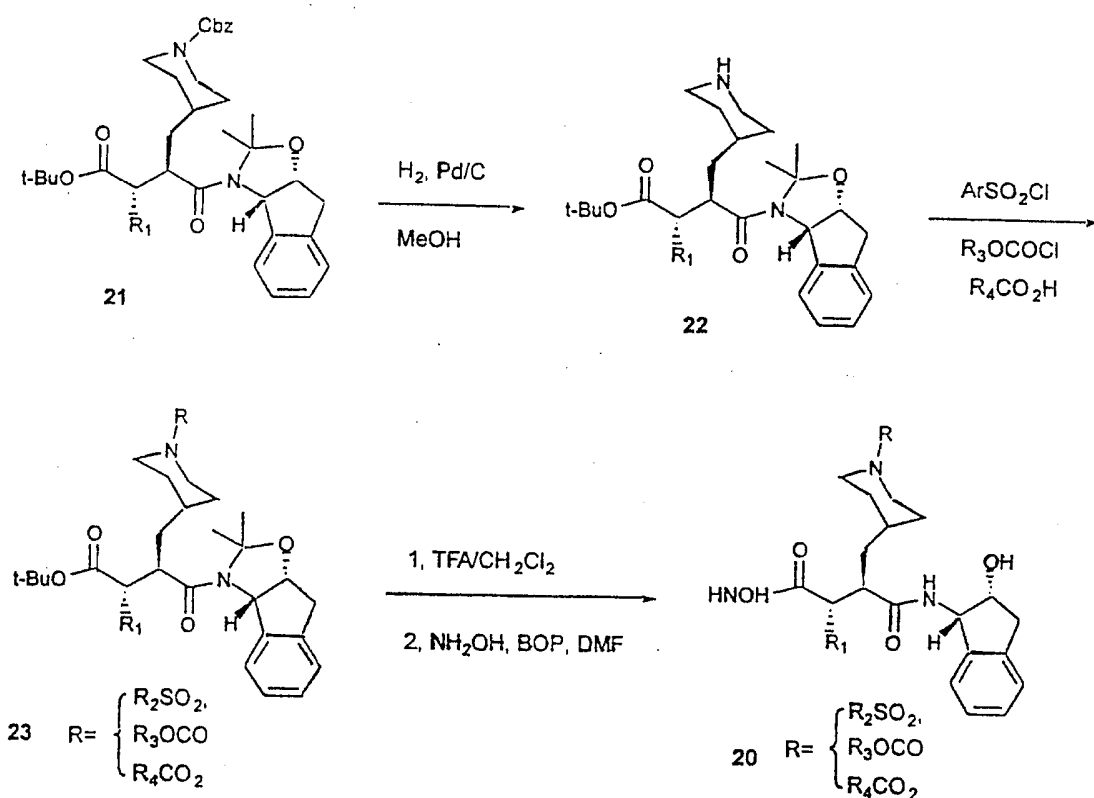
Sloučeniny vzorce 19 se připraví jak je uvedeno ve schématu 4. Meziprodukt 15 připravený za použití způsobu popsaném ve schématu 3 se hydrogenuje za vzniku sloučeniny 16. Sloučenina 16 se potom převede na triflát 17. Pd katalyzovaná Suzukiho nebo Stilleho křížová kopulace triflátu 17 s buď kyselinou boronovou nebo organostananem se získá kopulační produkt 18. Za použití standarní chemie, jak je popsáno ve schématu 3, se může 18 snadno převést na sloučeniny vzorce 19.

Schéma 4



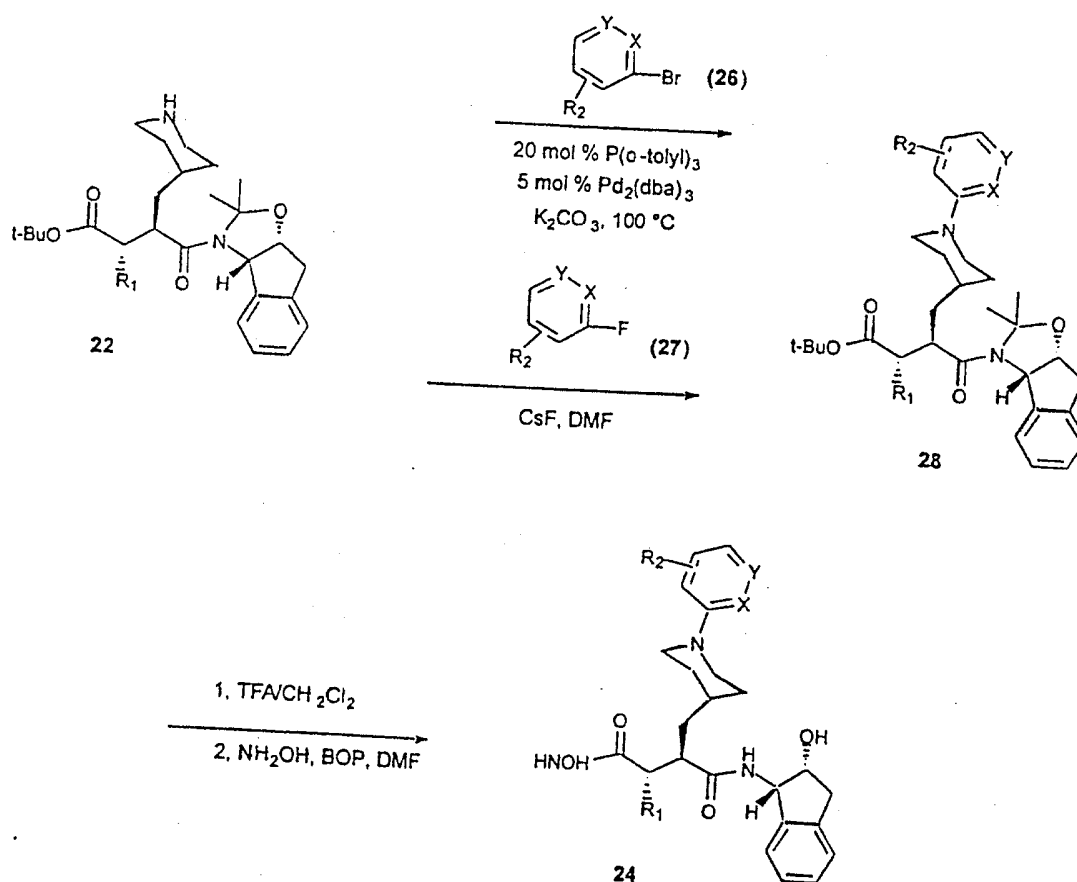
Sloučeniny vzorce 20 se připraví jak je uvedeno ve schématu 5. Sloučeniny 21 připravené jak je popsáno ve schématu 2 se mohou hydrogenovat za vzniku volného aminu 22. Volná aminoskupina se může potom chránit jako sulfonamidy, karbamáty a amidy 23. Následuje podobný postup jak je popsáno ve schématu 1, sloučeniny 23 se mohou snadno převést na cílovou sloučeninu vzorce 20.

Schéma 5



Sloučeniny 24 se připraví jak je uvedeno ve schématu 6. Vychází se z 22 připravené ve schématu 5, volná aminoskupina se může dále funkcionalizovat na žádanou sloučeninu 28 buď palladiem katalyzovanou aryllovou aminací (Wolfe, J. P.; Rennels, R. A.; Buchwald, S. L. *Tetrahedron*, 1996, 52, 7225-7546, Hartwig, J. F. *Synlett*, 1996, 329) nebo vytěsněním substituovaným arylfluoridem. Jak je popsáno v předchozím schématu 5, 28 se může snadno převést na finální sloučeninu 24.

Schéma 6

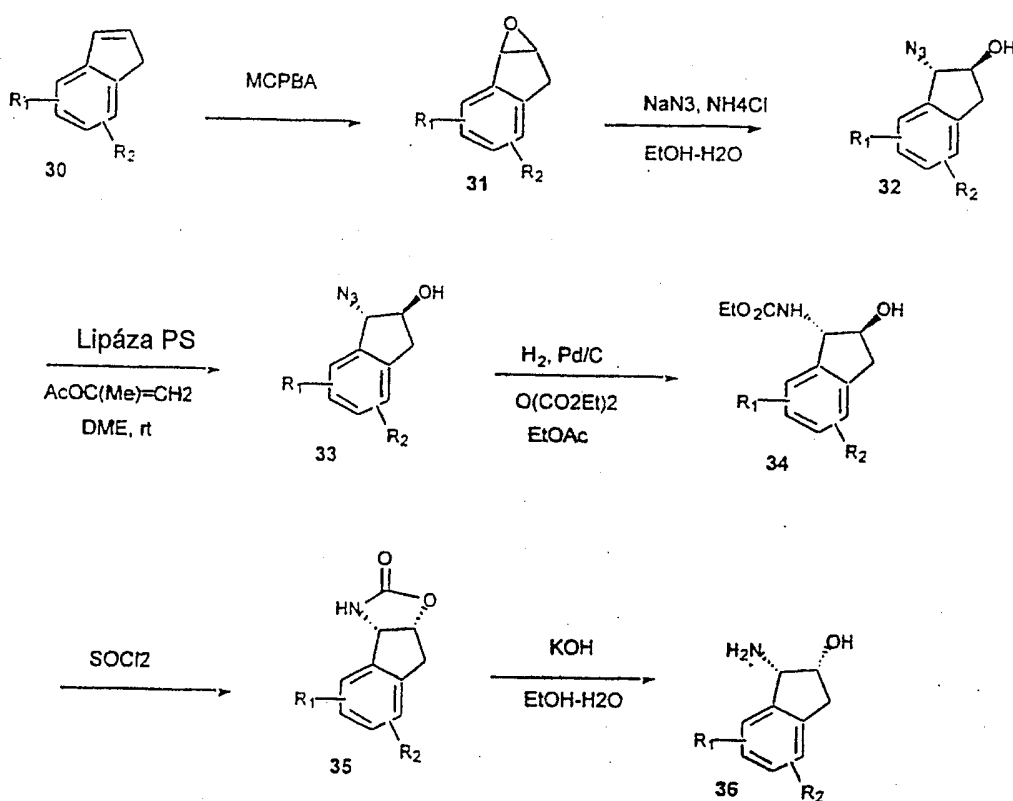


Sloučeniny vzorce 29 se připraví jak je uvedeno ve schématech 7 až 9.

Příprava substituovaného cis-1-amino-2-indanolu 36 se provedla způsobem vyvinutým Ghoshem a kol. (Ghosh, A. K.; Kincaid, J.F.; Haske, M. G. *Synthesis*, 1997, 541-544). Substituovaný inden 30 se převede na epoxid 31 s MCPBA nebo na opticky čistý epoxid 31 s Jacobsenovými vysoce enantioselektivními epoxidačními katalyzátory (Jacobsen, E. N.; Zhang, W; Muci,

A. R.; Ecker, J. R.; Deng, L. *J. Am. Chem. Soc.* 1991, 113, 7063-7064). Epoxid 31 se převede na alkohol 22 zpracováním s NaN_3 . Racemický alkohol 32 se znovu rozpustí lipázou PS jak popsali Ghosh a kol. (Ghosh, A. K.; Kincaid, J. F.; Haske, M. G. *Synthesis*, 1997, 541-544). Azid 33 se hydrogenuje v přítomnosti $\text{O}(\text{CO}_2\text{Et})_2$ za získání 34. Sloučenina 34 se potom převede na finální substituovaný cis-1-amino-2-indanol 36 nejprve smícháním s SOCl_2 , následované hydrolýzou.

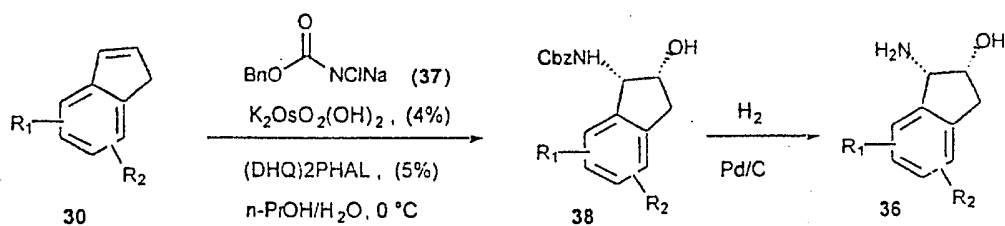
Schéma 7



Alternativně, substituovaný cis-1-amino-2-indanol 36 se přímo připraví ze substituovaného indenu 30 metodou, kterou dříve vyvinul Sharpless, K. B. jak je uvedeno ve schématu 8 (Li, G.; Angert, H. H.; Sharpless, K. B. *Angew Chem. Int. Ed.*

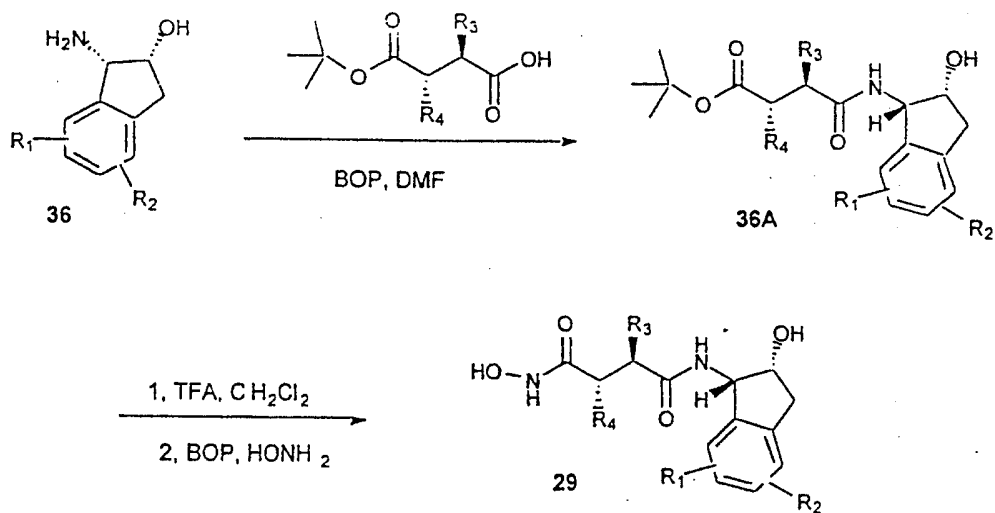
Engl. 1996, 35, 2813). Skupina cbz 38 se odstraní hydrogenací a získá se volný amin 36.

Schéma 8



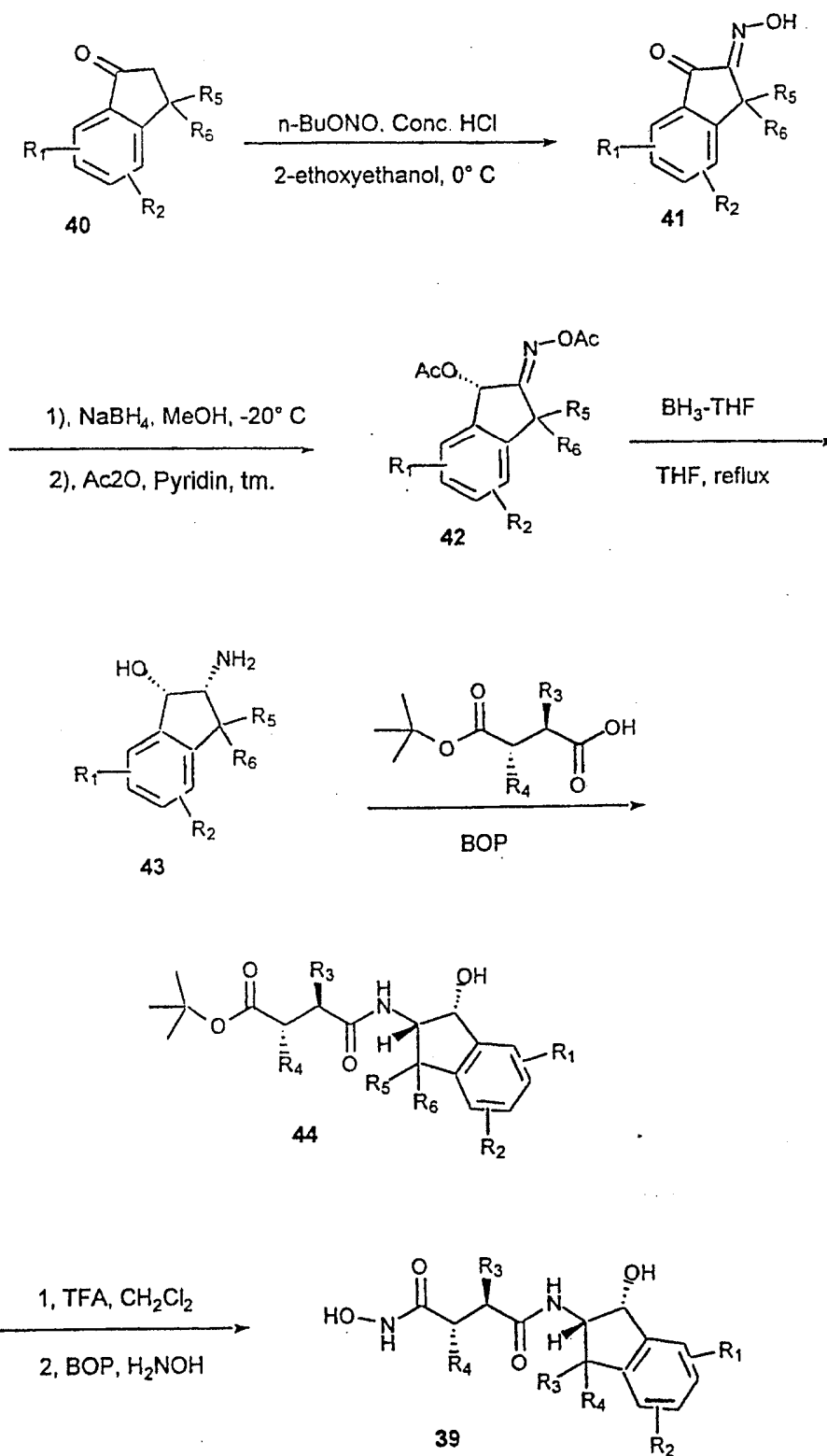
Následuje podobná sekvence, sloučenina 36 může být snadno převedena na finální sloučeninu 29 jak je uvedeno ve schématu 9.

Schéma 9



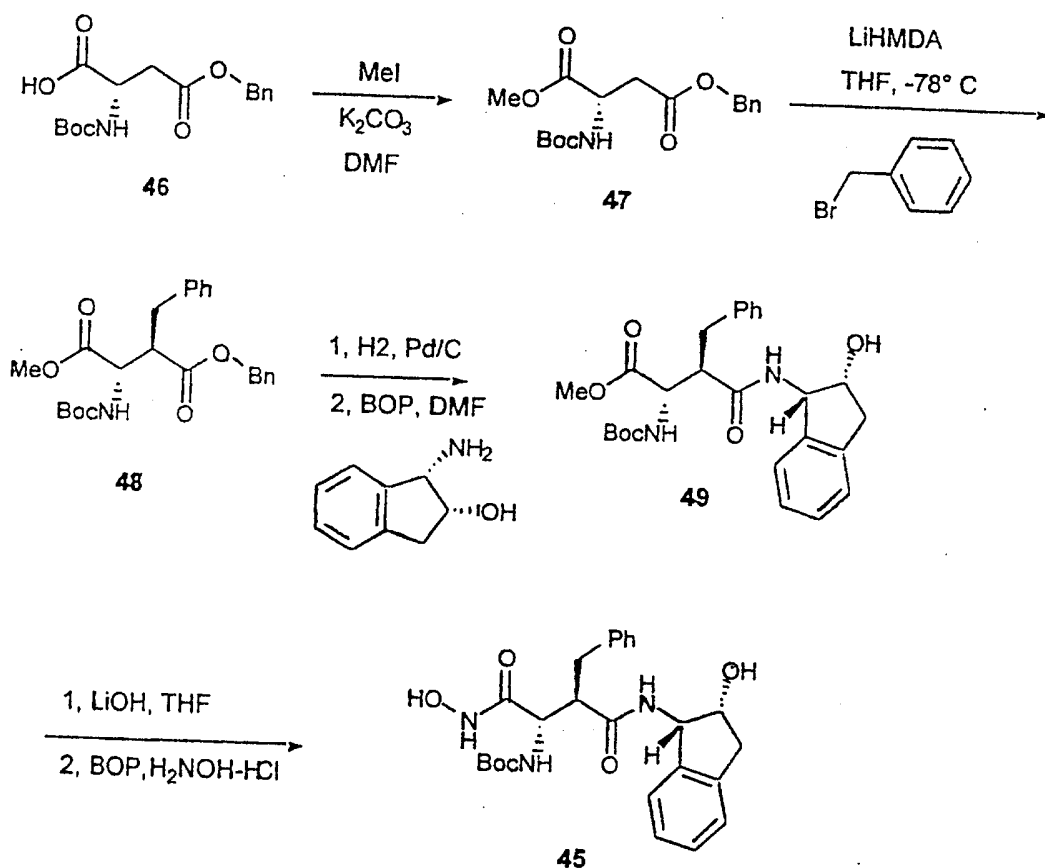
Sloučeniny 39 se mohou připravit jak je uvedeno ve schématu 10. Podle metody, kterou vyvinul Sudo a Saigo (Sudo, A.; Saigo, K. Tetrahedron Asymetry, 1996, 7, 2939-2956), racemický cis-2-amino-1-indanol může být snadno připraven ze substituovaného indanonu 40, jak je uvedeno ve schématu 9. Indanon se může snadno převést na oxim 41 s butylnitrilem při kyselých podmínkách. Redukcí 41 s NaBH_4 v methanolu může poskytovat hydroxyoxim, který se zpracuje anhydridem kyseliny octové a pyridinem a získá se diacetát 42. Boranovou redukcí 42 se potom získá racemická sloučenina 43, která se může použít přímo nebo se rozštěpí kokrystalizací s kyselinou vinnou nebo jinými za vzniku žádaného enantiometricky čistého aminu 43. Za použití podobných postupů, jak jsou použity pro přípravu cílové sloučeniny 5, jak je popsáno ve schématu 1, sloučenina 44 se může snadno převést na cílovou sloučeninu 39.

Schéma 10



Sloučeniny vzorce 45 se připraví jak je uvedeno ve schématu 11. Karboxylová skupina komerčně dostupné kyseliny aspartové se chrání jako methylester 47. Sloučenina 47 se potom zpracuje s LiHMDS v THF při -78°C za vzniku enolátu, který reaguje s benzylbromidem za vzniku 48. Benzylová skupina 48 se odstraní hydrogenací. Vzniklá kyselina se potom kopuluje s *cis*-2-amino indanolem a získá se 49. Hydrolyzou sloučeniny 49, následovanou kopulací s hydroxyaminem se získá cílová sloučenina 45.

Schéma 11



Příklady provedení vynálezu

Zkratky používané v příkladech mají následující význam: "1 x" znamená jednou, "2 x" znamená dvakrát, "3 x" znamená třikrát, "°C" znamená stupně Celsia, "ekv." znamená ekvivalent nebo ekvivalenty, "g" znamená gram nebo gramy, "mg" znamená miligram nebo miligramy, "ml" znamená mililitr nebo mililitry, "¹H" znamená proton, "hod." znamená hodinu nebo hodiny, "M" znamená molární, "min" znamená minutu nebo minuty, "MHz" znamená megahertz, "MS" znamená hmotnostní spektroskopii, "NMR" znamená nukleární magnetickou rezonanci, "t.m." znamená teplotu místnosti, "tlc" znamená chromatografii na tenké vrstvě, "objem./objem" znamená poměr objemu k objemu. "R" a "S" jsou stereochemická označení známé odborníkům.

Příklad 1

N1-(2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-butandiamid

(a) N1-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-isobutyl-3-(terc.butoxy-karbonyl)propanamid:

K míchanému, chlazenému (0 °C) roztoku 500 mg (2,17 mmol) 2R-isobutyl 3-(terc.butoxykarbonyl)propionové kyseliny a 323,9 mg (2,17 mmol) (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolu v 4,0 ml bezvodého DMF se přidá 731,4 mg TBTU, a poté se přidá 1,19 ml diisopropylethylaminu. Reakční směs se nechá zahřát na teplotu místnosti. Po 1 hodině se reakční směs zředí 15 ml 10% kyseliny citronové a 50 ml ethylacetátu, vodný roztok se dále extrahuje s ethylacetátem (2 x 25 ml). Spojený organický roztok se promyje vodou, nasyceným NaHCO₃ a solankou a suší se nad MgSO₄. Roztok se filtruje a koncentruje se za sníženého tlaku a získá se 0,685 g (87% výtěžek) jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺; vypočteno 362, nalezeno 362.

(b) N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-isobutyl-3-(hydroxykarbonyl)propanamid

K roztoku 0,635 g N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-isobutyl-3-(terc.butoxykarbonyl) propanamidu v 4,5 ml methylenchloridu a 0,5 ml vody se po kapkách přidá 5,0 ml TFA. Reakční směs se míchá při teplotě místnosti 50 minut. Směs se potom koncentruje a suší koodpařováním s toluenem (3 x 50 ml). Vzniklý materiál se použije přímo v dalším stupni. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 306, nalezeno 306.

(c) N1-2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-isobutylbutandiamid

K chladnému roztoku (0 °C) 502 mg N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-isobutyl-3-(hydroxykarbonyl)propanamidu v 6,4 ml DMF se přidá 786,5 mg O-benzyl hydroxyamin-HCl a 684,6 mg TBTU a následuje přidání 1,71 ml ethyldiisoprylaminu. Reakční směs se míchá při 0 °C po dobu 15 minut a ohřeje se na teplotu místnosti. Po 4 hodinách se reakční směs vlije do ethylacetátu/5% kyselina citronová a vodný roztok se extrahuje s ethylacetátem (3 x 25 ml). Spojený organický roztok se promyje 5% kyselinou citronovou, vodou, nasyceným NaHCO₃, solankou a suší se nad MgSO₄. Roztok se filtruje a koncentruje a získá se 647 mg žádaného produktu jako bílá pevná látka.

K 323,5 mg shora uvedené látky v 20 ml methanolu se přidá 500 mg 5% Pd/BaSO₄. Směs se třepe při 3,515 kg/cm² vodíku po dobu 16 hodin. Reakční směs se filtruje a koncentruje a čistí se reverzní HPLC a získá se 110 mg žádané kyseliny hydroxámové jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 321, nalezeno 321.

Příklad 2

N1- (2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-
- (3-propionová kyselina)

Následuje postup, který je analogický postupu použitým v příkladu 1, 2R-isobutyl 3S-(terc.butoxykarbonyl) 5-benzoxycarbonyl pentanová kyselina se kopuluje s (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolem za použití TBTU jako kopulační složkou. Odstranění terc.butylové chránicí skupiny se provede zpracováním s TFA jak je popsáno v příkladu 1, následované kopulací s O-benzyl hydroxyamin-HCl vyvolanou TBTU. Výsledný materiál se hydrogenuje a získá se žádaný produkt. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 393, nalezeno 393.

Příklad 3

N1- (2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-
-methylbutandiamid

Následuje postup, který je analogický postupu použitým v příkladu 1, 2R-hexyl 3S-(terc.butoxykarbonyl) butanová kyselina se kopuluje s (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolem za použití TBTU jako kopulační složkou. Odstranění terc.butylové chránicí skupiny se provede zpracováním s TFA jak je popsáno v příkladu 1, následované kopulací s O-benzyl hydroxyamin-HCl vyvolanou TBTU nebo BOP. Vzniklý materiál se hydrogenuje a získá se žádaný produkt, jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 335, nalezeno 335.

Příklad 4

N1- (2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-
-propylbutandiamid

Následuje postup, který je analogický postupu použitým v příkladu 1, 2R-isobutyl 3S-(terc.butoxykarbonyl) hexanová kyselina se kopuluje s (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolem

za použití TBTU jako kopulační složkou. Odstranění terc.butylové chránící skupiny se provede zpracováním s TFA jak je popsáno v příkladu 1, následované kopulací s O-benzyl hydroxyamin-HCl vyvolanou TBTU nebo BOP. Vzniklý materiál se hydrogenuje a získá se žádaný produkt, jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 363, nalezeno 363.

Příklad 5

N1-(2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl)-N4-hydroxy-2(R)-hexyl-3(S)-
-propylbutandiamid

Následuje postup, který je analogický postupu použitým v příkladu 1, 2R-hexyl 3S-(terc.butoxykarbonyl) hexanová kyselina se kopuluje s (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolem za použití TBTU jako kopulační složkou. Odstranění terc.butylové chránící skupiny se provede zpracováním s TFA jak je popsáno v příkladu 1, následované kopulací s O-benzyl hydroxyamin-HCl vyvolanou TBTU nebo BOP. Vzniklý materiál se hydrogenuje a získá se žádaný produkt, jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 391, nalezeno 391.

Příklad 6

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-hydroxy-
fenyl)methylbutandiamid

(a) Příprava N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-3-(4-benzyloxyfenyl)-
propanamidu

K míchanému chladnému (0 °C) roztoku 10 g (39,1 mmol) 3-(4-benzyloxyfenyl)propionové kyseliny a 7 g (46,92 mmol) (1S, 2R)-(-) cis-1-amino-2-indanolu v 200 ml bezvodého DMF se přidá 17,3 g BOP jako pevná látka a následuje přidání 20 ml diethylisopropylaminu. Reakční směs se nechá zahřát na teplotu místnosti. Po 5 hodinách se reakční směs zředí 100 ml

10% kyseliny citronové a 100 ml ethylacetátu a vodný roztok se dále extrahuje s ethylacetátem (2 x 50 ml). Spojený organický roztok se promyje vodou, nasyceným NaHCO_3 a solankou a suší se nad MgSO_4 . Roztok se filtruje a koncentruje za sníženého tlaku a získá se 15,1 g žádaného produktu jako bílá pevná látka. ESI-MS $(\text{M}+\text{H})^+$: vypočteno 388, nalezeno 388.

(b) N-(1S, 2R-N,O-dimethyl acetonid-indanyl)-3-(4-benzyloxy-fenyl)propanamid

K míchanému chladnému (0 °C) roztoku 15,1 g N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-3-(4-benzyloxyfenyl)propanamidu a 1,14 g PPTS v 300 ml methylenchloridu se pomalu přidá 30 ml 2-methoxypropenu. Roztok se pomalu zahřívá na teplotu místnosti a míchá se přes noc. Reakce se zchladí přidáním 50 ml nasyc. NaHCO_3 a extrahuje se s ethylacetátem (3 x 50 ml). Spojený roztok se promyje nasyceným NaHCO_3 , vodou, solankou a suší se nad MgSO_4 . Roztok se filtruje a koncentruje. Surový materiál se čistí mžikovou sloupcovou chromatografií (ethylacetát/hexan: 40:60) a získá se 15,3 g žádaného produktu jako bílá pevná látka. ESI-MS $(\text{M}+\text{H})^+$: vypočteno 428, nalezeno 428.

(c) N-(1S, 2R-N,O-dimethyl acetonidindanyl)-2R-(4-benzyloxy-fenylmethyl)-3-(terc.butoxykarbonylpropanamid

K míchanému a chladnému (-78 °C) roztoku 3,0 g (7,0 mmol) N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-3-(4-benzyloxyfenyl)propanamidu v 20 ml THF se přidá po kapkách čerstvě připravená, chladná LDA (7,0 mmol) v THF. Po jedné hodině se přidá po kapkách roztok 1,14 ml (7,7 mmol) terc.butyl 2-bromacetátu v 3,0 ml THF. Vzniklý roztok se inkubuje při -78 °C po dobu 4 hodin. Reakce se ochladí přidáním 10% kyseliny citronové a extrahuje se ethylacetátem (3 x 100 ml). Spojený organický roztok se promyje vodou, solankou a suší se nad MgSO_4 . Roztok se filtruje a koncentruje. Surový materiál se čistí mžikovou chromatografií (ethylacetát/hexany: 15-25:85-75) a získá se

žádaný produkt (2,8 g, 71% výtěžek) jako bílá pevná látka a 0,1 g dalších diastereomerů. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 542, nalezeno 542.

(d) N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-benzyloxyfenylmethyl)-3-(hydroxykarbonyl)propanamid

K roztoku 1,13 g N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-benzyloxyfenylmethyl)-3-(terc.butoxykarbonyl)propanamidu v 7,6 ml methylenchloridu a 0,4 ml vody se po kapkách přidá 8,0 ml TFA. Reakční směs se míchá při teplotě místnosti 50 minut. Směs se koncentruje na polovinu původního objemu. Zbytek se potom suší koodpařením s toluenem (3 x 15 ml) a použije se přímo v dalším stupni. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 446, nalezeno 446.

(e) N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-benzyloxyfenylmethyl)-3-(N-hydroxyaminokarbonyl)propanamid

K chladnému (0 °C) roztoku 104 mg N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-benzyloxyfenylmethyl)-3-(hydroxykarbonyl)propanamidu v 1,2 ml DMF se přidá 112 mg O-benzyl hydroxylamin-HCl a 78,8 mg TBTU a následuje přidání 0,24 ml ethyldiisopropylaminu. Reakční směs se míchá při 0 °C po dobu 15 minut a ohřeje se na teplotu místnosti. Po 2 hodinách se reakční směs vlije do směsi ethylacetátu a 5% kyseliny citronové, vodný roztok se extrahuje s ethylacetátem (3 x 25 ml). Spojený organický roztok se promyje 5% kyselinou citronovou, vodou, nasyceným NaHCO₃, solankou a suší se nad MgSO₄. Roztok se filtruje a koncentruje a získá se 105 mg žádaného produktu.

K 105 mg shora uvedeného produktu v 6 ml methanolu se přidá 60 mg 5% Pd/BaSO₄. Směs se třepe pod 3,515 kg/cm² H₂ po dobu 4 hodin. Reakční směs se filtruje a koncentruje a čistí se reverzní HPLC a získá se 47 mg žádané kyseliny hydroxámové jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 371, nalezeno

371.

Příklad 7

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-methoxy-fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 385, nalezeno 385.

Příklad 8

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-hydroxy-fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 355, nalezeno 355.

Příklad 9

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-fenyl-propyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 383, nalezeno 383.

Příklad 10

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyl-oxy)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 461, nalezeno 461.

Příklad 11

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-(benzyloxy)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 461, nalezeno 461.

Příklad 12

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxyfenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 371, nalezeno 371.

Příklad 13

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-fluorfenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 373, nalezeno 373.

Příklad 14

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3,4-methylenedioxyfenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 379, nalezeno 379.

Příklad 15

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-methoxyfenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.

ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 385, nalezeno 385.

Příklad 16

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-fenyl)fenyl)methyl]butandiamid

(a) N-(1S, 2R-N,O-dimethyl acetonidindanyl)-2R-(4-fenyl)-fenylmethyl-3-(terc.butoxykarbonyl)propanamid

K 2,6 g N-(1S, 2R-N,O-dimethyl acetonidindanyl)-2R-(4-benzyloxyfenylmethyl)-3-terc.butoxykarbonyl)propanamidu v 20 ml methanolu se přidá 300 mg 5% Pd/C. Směs se třepe pod 3,515 kg/cm² H₂ po dobu 17 hodin. Reakční směs se filtruje a koncentrováním se získá 2,0 g žádaného produktu.

K ochlazenému (0 °C) roztoku 1,2 g N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-hydroxyfenylmethyl)-3-terc.butoxykarbonyl)propanamidu a 0,95 g PhN(tf)₂ v 9 ml methylenchloridu se přidá po kapkách 0,77 ml Et₃N. Po 45 minutách při 0 °C se reakční směs zředí ethyletherem (60 ml), promyje se nasyceným NaHCO₃, solankou a suší se nad MgSO₄. Surový materiál se čistí mžikovou chromatografií s 20% ethylacetátem v hexanu a získá se žádaný produkt jako bezbarvý olej.

K roztoku 192,0 mg shora uvedeného materiálu a 22 mg PPh₃ v 1,4 ml toluenu a 1,4 ml 0,35M vodného roztoku Na₂CO₃ se přidá katalytické množství (6,0 mg) Pd(Ac)₂. Vzniklá směs se míchá při 60 °C 10 minut a následuje přidání 44 mg benzenboronové kyseliny ve formě pevné látky. Reakční směs se zahřívá při 70 °C. Po čtyřech hodinách se reakční směs zředí ethylacetátem, promyje se vodou, solankou a suší se nad MgSO₄. Surový materiál se čistí 15% ethylacetátem v hexanu a získá se 127,1 mg žádaného produktu jako bezbarvý olej. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 431, nalezeno 431.

(b) N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-fenyl)fenylmethyl-3-
-(N-hydroxyaminokarbonyl)propanamid

Podle postupu použitým při přípravě popsané v příkladu 1, shora uvedený N-(1S, 2R-N,O-dimethyl acetonidindanyl)-2R-(4-fenyl)fenylmethyl-3-(terc.butoxykarbonyl)propanamid se zpracuje s TFA a následuje kopulace s hydroxylaminem a získá se žádaný N-(2R-hydroxy-1S-indanyl)-2R-(4-fenyl)fenylmethyl-3-(N-hydroxyaminokarbonyl)propanamid jako bílá pevná látka. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 431,2, nalezeno, 431,2

Příklad 17

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-
-terc.butylaminosulfonylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 566, nalezeno 566.

Příklad 18

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-
-methoxyfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 461, nalezeno 461.

Příklad 19

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-
-trifluormethylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina. ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 499, nalezeno 499.

Příklad 20

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-(3-hydroxy-4-methoxyfenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 401, nalezeno 401.

Příklad 21

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-(3-thiofen)isoxazolin)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 429, nalezeno 429.

Příklad 22

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-chlorfenyl)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 465,5, nalezeno 465,5.

Příklad 23

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-benzofuran)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 471, nalezeno 471.

Příklad 24

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-methylfenyl)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 445, nalezeno 445.

Příklad 25

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3,4-
-(methylenedioxyfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 475, nalezeno 475.

Příklad 26

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-
-(2-tetrazolfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 499, nalezeno 499.

Příklad 27

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-
-fenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 431, nalezeno 431.

Příklad 28

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-
-methylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 445, nalezeno 445.

Příklad 29

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (aminofenyl) fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 370, nalezeno 370.

Příklad 30

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (benzyloxykarbonyl) amino] fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 6 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 504, nalezeno 504.

Příklad 31

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (2-hydroxymethylfenyl) fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 461, nalezeno 461.

Příklad 32

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (3,4,5-trimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 521, nalezeno 521.

Příklad 33

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (2,4-dimethoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 491, nalezeno 491.

Příklad 34

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,5-dichlorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 499, nalezeno 499.

Příklad 35

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-trifluormethylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 499, nalezeno 499.

Příklad 36

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-isopropylfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 473, nalezeno 473.

Příklad 37

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dichlorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 499, nalezeno 499.

Příklad 38

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-chlor-4-fluorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 483, nalezeno 483.

Příklad 39

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(p-toluensulfonfylamino)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 524, nalezeno 524.

Příklad 40

N1- [2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid

K roztoku 20 g Boc-Asp(OBn)-OH a 8,9 g K₂CO₃ v 200 ml DMF se přidá 4,04 ml CH₃I. Reakční směs se míchá při teplotě místnosti 12 hodin. Reakční směs se zředí vodou a extrahuje se diethyletherem. Spojená organická vrstva se promyje nasyceným NaHCO₃, vodou a solankou. Surový materiál se rekrystaluje z diethyletheru a hexanu a získá se 19,2 g žádaného produktu Boc-Asp(OBn)-OCH₃.

K ochlazenému (-78 °C) roztoku 2,5 g sloučeniny Boc-Asp(OBn)-OCH₃ v 49 ml toluenu se přidá po kapkách v průběhu 15 minut 15,2 ml (1,0 M v THF) LiHMDS. Vzniklý roztok se míchá při -78 °C po dobu 1 hodiny a potom se přidá 1,4 ml benzylbromidu. Roztok se míchá při -50 °C přes noc. Reakční směs se ochladí 10% kyselinou citronovou a extrahuje se diethyletherem. Organická vrstva se promyje nasycenou solankou a suší se nad Na₂SO₄. Surový materiál se čistí 15%

ethylacetátem a získá se 2,1 g (64% výtěžek) žádaného produktu.

1,0 g (2,34 mmol) shora uvedeného produktu a 50 mg 10% Pd/C se hydrogenuje při 2,25 kg/cm² po dobu 2 hodin. Reakční směs se filtruje a koncentrací se získá zbytek.

678 mg (2,01 mol) shora uvedené kyseliny se kopuluje s 314 mg cis-2-aminoindanolu za použití 933 mg BOP jako kopulačního činidla v DMF a získá se 867 kopulačního produktu N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)--(terc.butyloxykarbonylamino)-4-(terc.butoxykarbonyl)butan-amidu.

K ochlazenému roztoku 268 mg N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)--(terc.butyloxykarbonylamino)-4-(terc.butoxykarbonyl)butanamidu v 4,3 ml THF se přidá 0,43 ml (2,5 M v H₂O) roztoku LiOH. Reakční směs se míchá při 0 °C po dobu 30 minut. Reakce se ochladí 10% kyselinou citronovou, extrahuje se EtOAc, organická vrstva se promyje nasyc. solankou a suší se nad Na₂SO₄. Rozpouštědlo se odstraní a získá se 252,1 mg produktu jako bílá pevná látka.

Shora uvedená kyselina (252 mg, 0,555 mol) se zpracuje s 257 mg BOP a 116 mg hydroxylaminu v DMF. Surový materiál se čistí RP-HPLC (kolona: 41,5 x 250 mm C18 dynamax, gradient: 15 až 65% acetonitril s 0,1% TFA v průběhu 25 minut. Vzorek se detekuje při 220 nM) a získá se žádaný materiál N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-fenylmethyl-3(S)--(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamidu, ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 470, nalezeno 470.

Příklad 41

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4-methylenedioxyfenyl)fenyl]methyl]-3(S)--(terc.butyloxykarbonyl-

16.02.00

amino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 588, nalezeno 588.

Příklad 42

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-methoxyfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 461, nalezeno 461.

Příklad 43

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-fluorfenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 449, nalezeno 449.

Příklad 44

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(fluorfenyl)methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 488, nalezeno 488.

Příklad 45

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxyfenyl)methyl]-3(S)-(terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 486, nalezeno 486.

Příklad 46

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-nitro-fenyl)fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 476, nalezeno 476.

Příklad 47

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-methyl-sulfonylamino)fenyl]fenyl]methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 524, nalezeno 524.

Příklad 48

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2,2-dimethylpropionamido)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 470, nalezeno 470.

Příklad 49

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(ethyloxykarbonylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 458, nalezeno 458.

Příklad 50

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-

15.02.00

fenyl)methyl]-3(S)-(isobutyloxykarbonylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 486, nalezeno 486.

Příklad 51

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(propionamid)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 458, nalezeno 458.

Příklad 52

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-methylcyklopropan karboxamido-1-yl)-butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 452, nalezeno 452.

Příklad 53

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2,2-dimethylpropylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.
ESI-MS (M+H)⁺: vypočteno 455, nalezeno 455.

Příklad 54

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(methylsulfonylamino)butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.

18.02.00

ESI-MS $(M+H)^+$: vypočteno 464, nalezeno 464.

Příklad 55

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-aminobutandiamid

Postupem popsaným v příkladu 40 se získá žádaná sloučenina.

ESI-MS $(M+H)^+$: vypočteno 386, nalezeno 386.

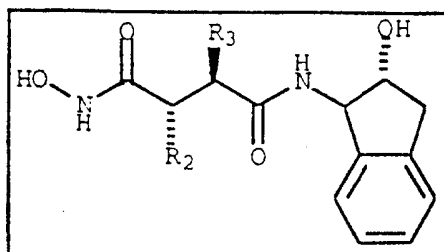
Příklad 56

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-(methyl-sulfonylamino)fenyl)methyl]butandiamid

Postupem popsaným v příkladu 16 se získá žádaná sloučenina.

ESI-MS $(M+H)^+$: vypočteno 448, nalezeno 448.

Tabulka 1

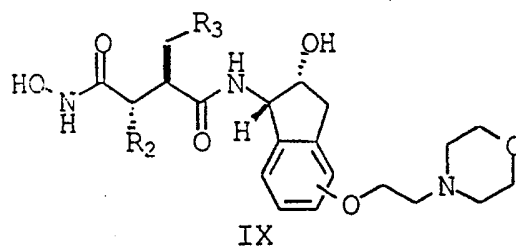
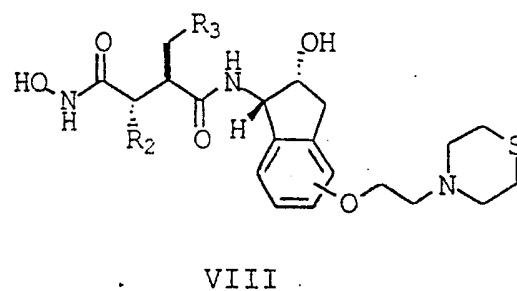
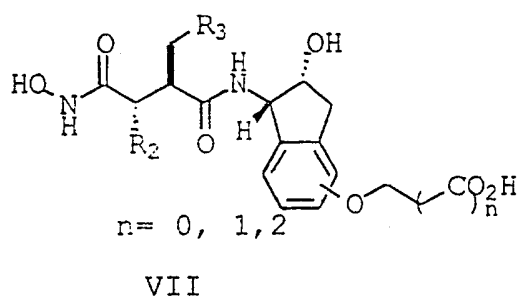
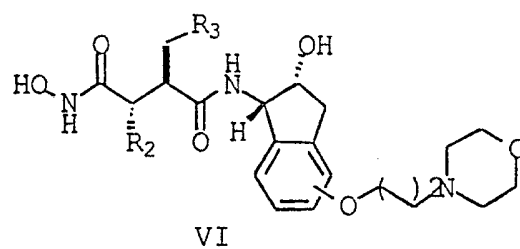
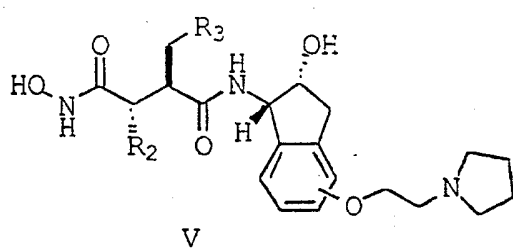
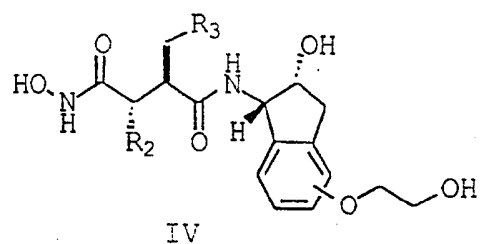
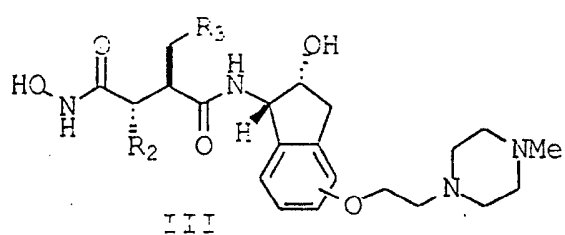
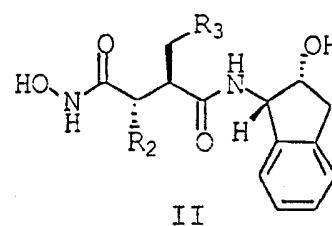
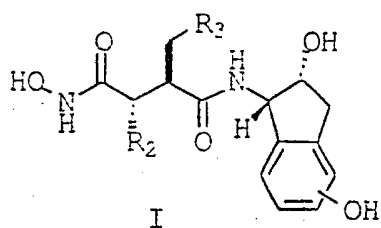


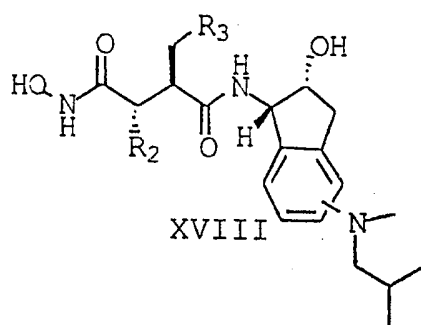
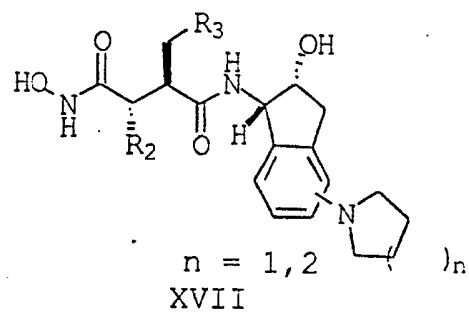
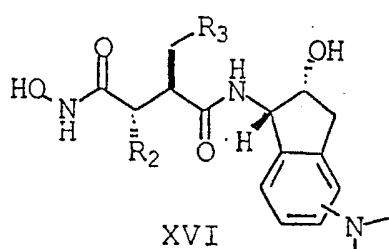
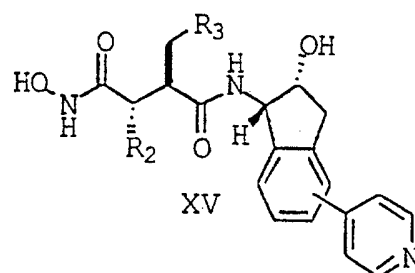
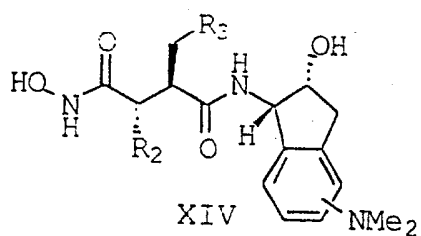
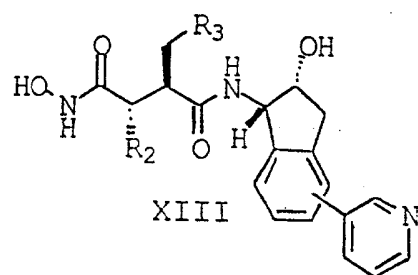
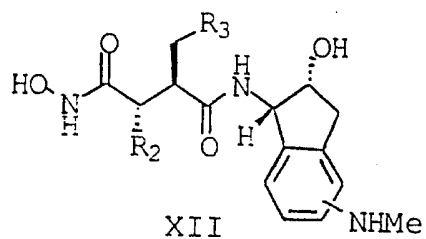
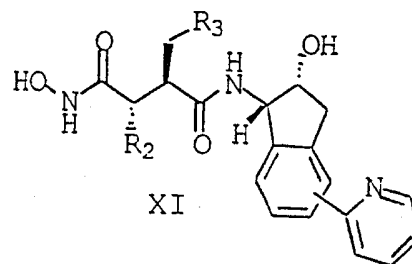
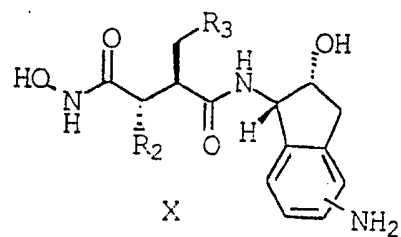
Př. č.	R ₂	R ₃	M+H
1	H	iso-butyl	321
2	CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	iso-butyl	393
3	metyl	iso-butyl	335
4	n-propyl	iso-butyl	363
5	n-propyl	n-C ₆ H ₁₃	391
6	H	4-hydroxyfenylmetyl	371
7	H	4-hydroxyfenylmetyl	385
8	H	4-hydroxyfenylmetyl	355
9	H	3-fenylpropyl	383
10	H	4-benzyloxyfenylmetyl	461
11	H	3-benzyloxyfenylmetyl	461
12	H	3-hydroxyfenylmetyl	371
13	H	4-fluorfenylmetyl	373
14	H	3,4-metylenedioxyfenylmetyl	379
15	H	3-methoxyfenylmetyl	385
16	H	4-fenyl-fenylmetyl	431
17	H	4-(2-(tertbutylaminosulfonyl)-fenylfenylmetyl	566
18	H	4-(2-methoxyfenyl)-fenylmetyl	461
19	H	4-(3-trifluormetylfenyl)-fenylmetyl	499
20	H	(3-hydroxy-4-methoxy)-fenylmetyl	401
21	H	3-(3-thiofen)-isoxazolin-metyl	429
22	H	4-(2-chlorofenyl)-fenylmetyl	465
23	H	4-(2-benzofuran)-fenylmetyl	471
24	H	4-(2-metylfenyl)-fenyl-metyl	445
25	H	(3,4-metylen-dioxyfenyl)-fenyl-metyl	475
26	H	4-(2-tetrazolfenyl)-fenyl-metyl	499
27	H	3-fenylfenylmetyl	431
28	H	(3-metyl-fenyl)-fenylmetyl	445
29	H	4-amino-fenylmetyl	370
30	H	4-benzyloxy-karbonyl-amino-fenylmetyl	504
31	H	4-(2-hydroxymetylen-fenyl)fenylmetyl	461
32	H	4-(3,4,5-trimethoxy-fenyl)fenylmetyl	521
33	H	4-(2,4-dimethoxy-fenyl)fenylmetyl	491
34	H	4-(3,5-dichlor-fenyl)-fenylmetyl	499
35	H	4-(2-trifluormetyl-fenyl)fenylmetyl	499
36	H	4-(3-isopropyl-fenyl)fenyl-metyl	473
37	H	4-(2,4-dichlor-fenyl)fenylmetyl	499
38	H	4-(3-chlor,4-flur-fenyl)fenylmetyl	483
39	H	4-(p-toluensulfonyl-amino)fenylmetyl	524
40	BocNH	fenylmetyl	470
41	BocNH	4-(3,4-metylenedioxy-fenyl)fenylmetyl	588
42	H	4-(3-methoxy-fenyl)fenylmetyl	461
43	H	4-(3-fluor-fenyl)fenylmetyl	449
44	BocNH	3-fluorfenylmetyl	488
45	BocNH	3-hydroxyfenylmetyl	486

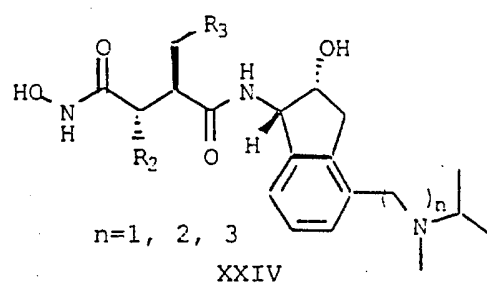
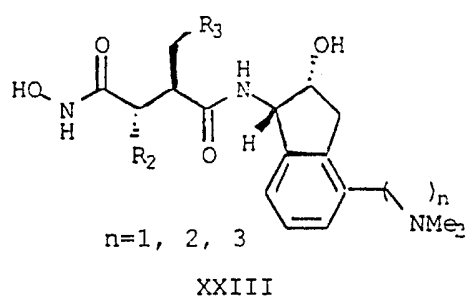
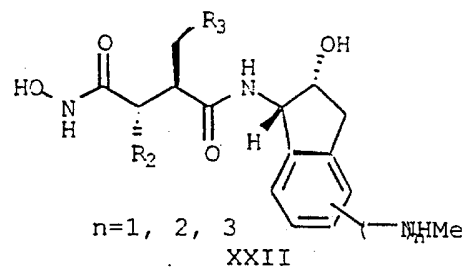
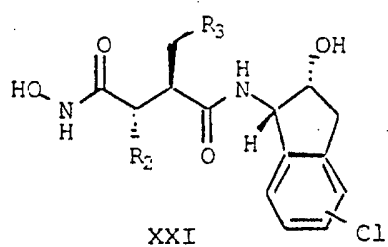
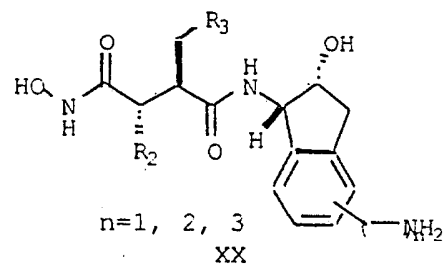
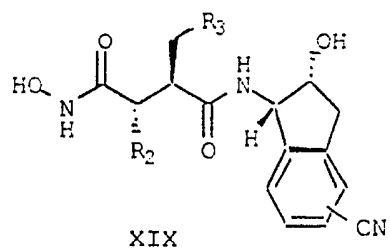
46	H	4-(3-nitro-fenyl)fenylmetyl	476
47	H	4-(3-metylsulfonylamino-fenyl)fenylmetyl	524
48	2,2-dimetylpropionamido	3-hydroxyfenylmetyl	470
49	ethoxykarbonylamino	3-hydroxyfenylmetyl	458
50	iso-butoxy-karbonyl-amin	3-hydroxyfenylmetyl	486
51	propioamido	3-hydroxyfenylmetyl	458
52	1-metylcyklopropankarboxamido-1-yl	3-hydroxyfenylmetyl	452
53	2,2-dimetylpropylamino	3-hydroxyfenylmetyl	455
54	metylsulfonylamino	3-hydroxyfenylmetyl	464
55	amino	3-hydroxyfenylmetyl	386
56	H	4-(metylsulfonyl-amino)fenylmetyl	448

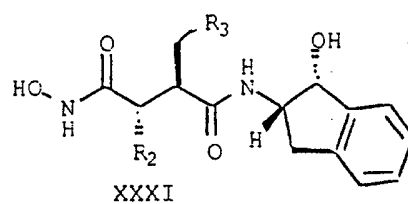
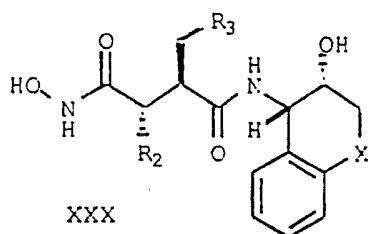
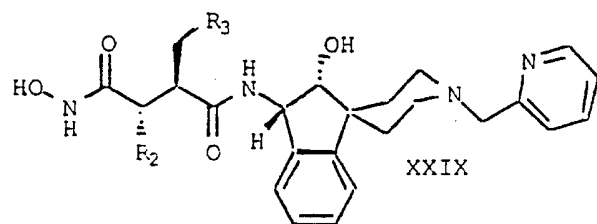
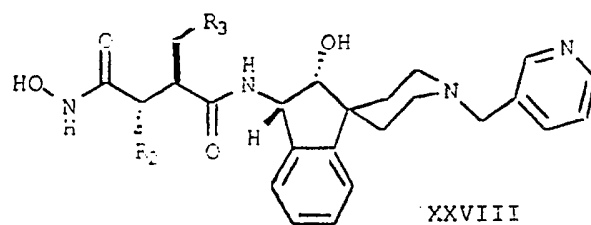
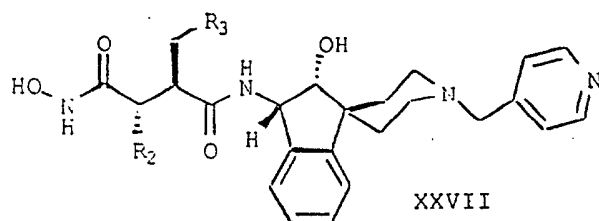
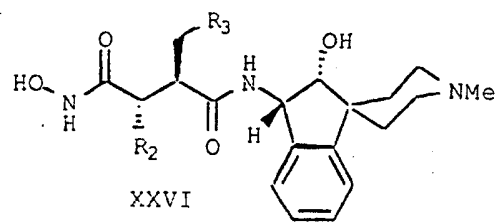
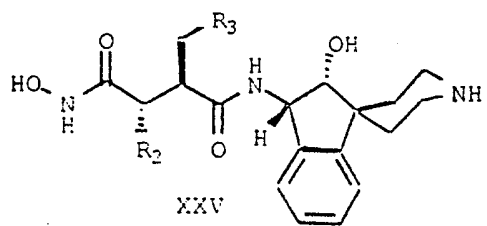
Následující tabulky představují reprezentativní příklady předkládaného vynálezu. Každý údaj v každé tabulce je svázán se vzorcem na začátku tabulky.

Tabulka 2

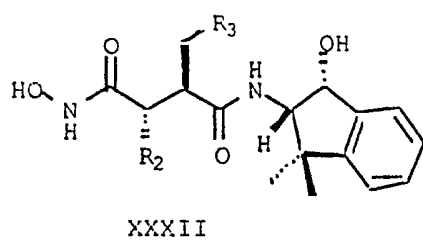








X = CH₂, O, S, S(O₂), S(O)



Př. č.	R2	R3	Ms
200	H	H	
201	H	metyl	
202	H	etyl	
203	H	n-propyl	
204	H	n-butyl	
205	H	n-pentyl	
206	H	n-hexanyl	
207	H	n-heptanyl	
208	H	isopropyl	
209	H	terc.butyl	
210	H	cyklopropyl	
211	H	cyklobutanyl	
212	H	cyklopentanyl	
213	H	cyklohexanyl	
214	H	cykloheptanyl	
215	H	fenyl	
216	H	fenylmetyl	
217	H	3-hydroxyfenyl	
218	H	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
219	H	3-fluorfenyl	
220	H	3-chlorofenyl	
221	H	3-nitrofenyl	
222	H	3-aminofenyl	
223	H	3-metylsufonamidfenyl	
224	H	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
225	H	3-Ac-NHfenyl	
226	H	3-Boc-NHfenyl	
227	H	3-Cbz-NHfenyl	
228	H	3-aminometylenfenyl	
229	H	3-aminoetylenfenyl	
230	H	3-kyanofenyl	
231	H	3-kyanometylfenyl	
232	H	3-hydroxymetylenfenyl	
233	H	3-karboxylfenyl	
234	H	3-merkaptofenyl	
235	H	3-methoxyfenyl	
236	H	3,4-metylendioxofenyl	
237	H	3-tetrazolfenyl	
238	H	3-aminosulfonylfenyl	
249	H	3-metylamino-sulfonylfenyl	
240	H	3-etylamo-sulfonylfenyl	
241	H	3-terc.butylamo-sulfonylfenyl	
242	H	3-metylsulfonylfenyl	
243	H	4-methoxyfenyl	
244	H	4-fenylfenyl	
245	H	(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
246	H	(2-terc.butylamo-sulfonylfenyl)-fenyl	
247	H	(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
248	H	(2-ethylamo-sulfonylfenyl)-fenyl	
259	H	(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
250	H	(2-chlorfenyl)-fenyl	
251	H	(2-fluorfenyl)-fenyl	
252	H	(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
253	H	(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
254	H	(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
256	H	(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	

257	H	(2-metylfenyl)-fenyl	
258	H	(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
259	H	(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
260	H	(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
261	H	(2-formyl-fenyl)-fenyl	
262	H	(2-amino-fenyl)-fenyl	
263	H	(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
264	H	(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
265	H	(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
266	H	(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
267	H	(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
268	H	(3-metylfenyl)-fenyl	
269	H	(3-isopropylfenyl)-fenyl	
270	H	(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
271	H	(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
272	H	(3-amino-fenyl)-fenyl	
273	H	(3-nitro-fenyl)-fenyl	
274	H	2-pyridyl	
275	H	3-pyridyl	
276	H	4-pyridyl	
277	H	3-amino-4-pyridyl	
278	H	3-hydroxy-4-pyridyl	
279	H	3-imidazol	
280	H	2-nitro-3-imidazol	
281	H	5-thiazol	
282	H	5-oxazol	
283	H	4-pyrazol	
284	H	fenylethyl	
285	H	2-aminofenylethyl	
286	H	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
287	H	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
288	H	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
289	H	2-aminomethylen-fenylethyl	
290	H	2-tetrazolfenylethyl	
291	H	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
292	H	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
293	H	2-methoxyfenylethyl	
294	H	3-aminofenylethyl	
295	H	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
296	H	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
297	H	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
298	H	3-aminomethylen-fenylethyl	
299	H	3-tetrazolfenylethyl	
300	H	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
301	H	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
302	H	3-methoxyfenylethyl	
200	H	H	
201	H	metyl	
202	H	etyl	
203	H	n-propyl	
204	H	n-butyl	
205	H	n-pentyl	
206	H	n-hexanyl	
207	H	n-heptanyl	
208	H	isopropyl	
209	H	terc.butyl	
210	H	cyklopropyl	
211	H	cyklobutanyl	

212	H	cyklopentanyl	
213	H	cyklohexanyl	
214	H	cykloheptanyl	
215	H	fenyl	
216	H	fenylmetyl	
217	H	3-hydroxyfenyl	
218	H	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
219	H	3-fluorfenyl	
220	H	3-chlorofenyl	
221	H	3-nitrofenyl	
222	H	3-aminofenyl	
223	H	3-metylsufonamidfenyl	
224	H	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
225	H	3-Ac-NHfenyl	
226	H	3-Boc-NHfenyl	
227	H	3-Cbz-NHfenyl	
228	H	3-aminometylenfenyl	
229	H	3-aminoetylenfenyl	
230	H	3-kyanofenyl	
231	H	3-kyanometylfenyl	
232	H	3-hydroxymetylenfenyl	
233	H	3-karboxylfenyl	
234	H	3-merkaptofenyl	
235	H	3-methoxyfenyl	
236	H	3,4-metylendioxofenyl	
237	H	3-tetrazolfenyl	
238	H	3-aminosulfonylfenyl	
249	H	3-metylamino-sulfonylfenyl	
240	H	3-etylamino-sulfonylfenyl	
241	H	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
242	H	3-metylsulfonylfenyl	
243	H	4-methoxyfenyl	
244	H	4-fenylfenyl	
245	H	(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
246	H	(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
247	H	(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
248	H	(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
259	H	(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
250	H	(2-chlorfenyl)-fenyl	
251	H	(2-fluorfenyl)-fenyl	
252	H	(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
253	H	(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
254	H	(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
256	H	(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
257	H	(2-metylfenyl)-fenyl	
258	H	(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
259	H	(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
260	H	(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
261	H	(2-formyl-fenyl)-fenyl	
262	H	(2-amino-fenyl)-fenyl	
263	H	(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
264	H	(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
265	H	(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
266	H	(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
267	H	(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
268	H	(3-metylfenyl)-fenyl	
269	H	(3-isopropylfenyl)-fenyl	
270	H	(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	

271	H	(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
272	H	(3-amino-fenyl)-fenyl	
273	H	(3-nitro-fenyl)-fenyl	
274	H	2-pyridyl	
275	H	3-pyridyl	
276	H	4-pyridyl	
277	H	3-amino-4-pyridyl	
278	H	3-hydroxy-4-pyridyl	
279	H	3-imidazol	
280	H	2-nitro-3-imidazol	
281	H	5-thiazol	
282	H	5-oxazol	
283	H	4-pyrazol	
284	H	fenylethyl	
285	H	2-aminofenylethyl	
286	H	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
287	H	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
288	H	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
289	H	2-aminomethylen-fenylethyl	
290	H	2-tetrazolfenylethyl	
291	H	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
292	H	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
293	H	2-methoxyfenylethyl	
294	H	3-aminofenylethyl	
295	H	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
296	H	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
297	H	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
298	H	3-aminomethylen-fenylethyl	
299	H	3-tetrazolfenylethyl	
300	H	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
301	H	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
302	H	3-methoxyfenylethyl	
200	H	H	
201	H	metyl	
202	H	etyl	
203	H	n-propyl	
204	H	n-butyl	
205	H	n-pentyl	
206	H	n-hexanyl	
207	H	n-heptanyl	
208	H	isopropyl	
209	H	terc.butyl	
210	H	cyklopropyl	
211	H	cyklobutanyl	
212	H	cyklopentanyl	
213	H	cyklohexanyl	
214	H	cykloheptanyl	
215	H	fenyl	
216	H	fenylmetyl	
217	H	3-hydroxyfenyl	
218	H	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
219	H	3-fluorfenyl	
220	H	3-chlorofenyl	
221	H	3-nitrofenyl	
222	H	3-aminofenyl	
223	H	3-metylsufonamidfenyl	
224	H	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
225	H	3-Ac-NHfenyl	

226	H	3-Boc-NHfenyl	
227	H	3-Cbz-NHfenyl	
228	H	3-aminometylenfenyl	
229	H	3-aminoetylenfenyl	
230	H	3-kyanofenyl	
231	H	3-kyanometylfenyl	
232	H	3-hydroxymetylenfenyl	
233	H	3-karboxylfenyl	
234	H	3-merkaptofenyl	
235	H	3-methoxyfenyl	
236	H	3,4-metylendioxofenyl	
237	H	3-tetrazolfenyl	
238	H	3-aminosulfonylfenyl	
249	H	3-metylamino-sulfonylfenyl	
240	H	3-etylamino-sulfonylfenyl	
241	H	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
242	H	3-metylsulfonylfenyl	
243	H	4-methoxyfenyl	
244	H	4-fenylfenyl	
245	H	(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
246	H	(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
247	H	(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
248	H	(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
259	H	(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
250	H	(2-chlorfenyl)-fenyl	
251	H	(2-fluorfenyl)-fenyl	
252	H	(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
253	H	(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
254	H	(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
256	H	(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
257	H	(2-metylfenyl)-fenyl	
258	H	(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
259	H	(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
260	H	(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
261	H	(2-formyl-fenyl)-fenyl	
262	H	(2-amino-fenyl)-fenyl	
263	H	(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
264	H	(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
265	H	(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
266	H	(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
267	H	(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
268	H	(3-metylfenyl)-fenyl	
269	H	(3-isopropylfenyl)-fenyl	
270	H	(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
271	H	(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
272	H	(3-amino-fenyl)-fenyl	
273	H	(3-nitro-fenyl)-fenyl	
274	H	2-pyridyl	
275	H	3-pyridyl	
276	H	4-pyridyl	
277	H	3-amino-4-pyridyl	
278	H	3-hydroxy-4-pyridyl	
279	H	3-imidazol	
280	H	2-nitro-3-imidazol	
281	H	5-thiazol	
282	H	5-oxazol	
283	H	4-pyrazol	
284	H	fenylethyl	

285	H	2-aminofenylethyl	
286	H	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
287	H	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
288	H	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
289	H	2-aminomethylen-fenylethyl	
290	H	2-tetrazolfenylethyl	
291	H	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
292	H	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
293	H	2-methoxyfenylethyl	
294	H	3-aminofenylethyl	
295	H	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
296	H	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
297	H	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
298	H	3-aminomethylen-fenylethyl	
299	H	3-tetrazolfenylethyl	
300	H	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
301	H	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
302	H	3-methoxyfenylethyl	
303	METHYL	H	
304	METHYL	metyl	
305	METHYL	etyl	
306	METHYL	n-propyl	
307	METHYL	n-butyl	
308	METHYL	n-pentyl	
309	METHYL	n-hexanyl	
310	METHYL	n-heptanyl	
311	METHYL	isopropyl	
312	METHYL	terc.butyl	
313	METHYL	cyklopropyl	
314	METHYL	cyklobutanyl	
315	METHYL	cyklopentanyl	
316	METHYL	cyklohexanyl	
317	METHYL	cykloheptanyl	
318	METHYL	fenyl	
319	METHYL	fenylmetyl	
320	METHYL	3-hydroxyfenyl	
321	METHYL	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
322	METHYL	3-fluorfenyl	
323	METHYL	3-chlorofenyl	
324	METHYL	3-nitrofenyl	
325	METHYL	3-aminofenyl	
326	METHYL	3-metylsufonamidfenyl	
327	METHYL	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
328	METHYL	3-Ac-NHfenyl	
329	METHYL	3-Boc-NHfenyl	
330	METHYL	3-Cbz-NHfenyl	
331	METHYL	3-aminometylenfenyl	
332	METHYL	3-aminoetylenfenyl	
333	METHYL	3-kyanofenyl	
334	METHYL	3-kyanometylfenyl	
335	METHYL	3-hydroxymetylenfenyl	
336	METHYL	3-karboxylfenyl	
337	METHYL	3-merkaptofenyl	
338	METHYL	3-methoxyfenyl	
339	METHYL	3,4-metylendioxofenyl	
340	METHYL	3-tetrazolfenyl	
341	METHYL	3-aminosulfonylfenyl	
342	METHYL	3-metylamino-sulfonylfenyl	

343	METHYL	3-ethylamino-sulfonylphenyl	
344	METHYL	3-tert.butylamino-sulfonylphenyl	
345	METHYL	3-methylsulfonylphenyl	
346	METHYL	4-methoxyphenyl	
347	METHYL	4-phenylphenyl	
348	METHYL	(2-hydroxy-methylenphenyl)-phenyl	
349	METHYL	(2-tert.butylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
350	METHYL	(2-methylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
351	METHYL	(2-ethylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
352	METHYL	(2-amino-sulfonylphenyl)-phenyl	
353	METHYL	(2-chlorophenyl)-phenyl	
354	METHYL	(2-fluorophenyl)-phenyl	
355	METHYL	(2,4-dichlorophenyl)-phenyl	
356	METHYL	(2,6-dichlorophenyl)-phenyl	
357	METHYL	(3,5-dichlorophenyl)-phenyl	
358	METHYL	(2,3-dichlorophenyl)-phenyl	
359	METHYL	(2-methylphenyl)-phenyl	
360	METHYL	(2-tetrazol-phenyl)-phenyl	
361	METHYL	(2-methoxy-phenyl)-phenyl	
362	METHYL	(2-methyl-phenyl)-phenyl	
363	METHYL	(2-formyl-phenyl)-phenyl	
364	METHYL	(2-amino-phenyl)-phenyl	
365	METHYL	(2-methylamino-phenyl)-phenyl	
366	METHYL	(2-ethylamino-phenyl)-phenyl	
367	METHYL	(2-propylamino-phenyl)-phenyl	
368	METHYL	(2-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
369	METHYL	(2-trifluoromethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
370	METHYL	(3-methylphenyl)-phenyl	
371	METHYL	(3-isopropylphenyl)-phenyl	
372	METHYL	(3-trifluoromethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
373	METHYL	(3-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
374	METHYL	(3-amino-phenyl)-phenyl	
375	METHYL	(3-nitro-phenyl)-phenyl	
376	METHYL	2-pyridyl	
377	METHYL	3-pyridyl	
378	METHYL	4-pyridyl	
379	METHYL	3-amino-4-pyridyl	
380	METHYL	3-hydroxy-4-pyridyl	
381	METHYL	3-imidazol	
382	METHYL	2-nitro-3-imidazol	
383	METHYL	5-thiazol	
384	METHYL	5-oxazol	
385	METHYL	4-pyrazol	
386	METHYL	phenylethyl	
387	METHYL	2-aminophenylethyl	
388	METHYL	2-methylsulfonylamino-phenylethyl	
389	METHYL	2-trifluoromethylsulfonylamino-phenylethyl	
390	METHYL	2-hydroxymethylen-phenylethyl	
391	METHYL	2-aminomethylen-phenylethyl	
392	METHYL	2-tetrazolphenylethyl	
393	METHYL	2-tert.-butylamino-sulfonylphenylethyl	
394	METHYL	2-aminosulfonyl-phenylethyl	
395	METHYL	2-methoxyphenylethyl	
396	METHYL	3-aminophenylethyl	
397	METHYL	3-methylsulfonylamino-phenylethyl	
398	METHYL	3-trifluoromethylsulfonylamino-phenylethyl	
399	METHYL	3-hydroxymethylen-phenylethyl	
400	METHYL	3-aminomethylen-phenylethyl	

401	METHYL	3-tetrazolfenylethyl	
402	METHYL	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
403	METHYL	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
404	METHYL	3-methoxyfenylethyl	
405	OH	H	
406	OH	metyl	
407	OH	etyl	
408	OH	n-propyl	
409	OH	n-butyl	
410	OH	n-pentyl	
411	OH	n-hexanyl	
412	OH	n-heptanyl	
413	OH	isopropyl	
414	OH	terc.butyl	
415	OH	cyklopropyl	
416	OH	cyklobutanyl	
417	OH	cyklopentanyl	
418	OH	cyklohexanyl	
419	OH	cykloheptanyl	
420	OH	fenyl	
421	OH	fenylmetyl	
422	OH	3-hydroxyfenyl	
423	OH	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
424	OH	3-fluorfenyl	
425	OH	3-chlorofenyl	
426	OH	3-nitrofenyl	
427	OH	3-aminofenyl	
428	OH	3-metylsufonamidfenyl	
429	OH	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
430	OH	3-Ac-NHfenyl	
431	OH	3-Boc-NHfenyl	
432	OH	3-Cbz-NHfenyl	
433	OH	3-aminometylenfenyl	
434	OH	3-aminoetylenfenyl	
435	OH	3-kyanofenyl	
436	OH	3-kyanometylfenyl	
437	OH	3-hydroxymetylenfenyl	
438	OH	3-karboxylfenyl	
439	OH	3-merkaptofenyl	
440	OH	3-methoxyfenyl	
441	OH	3,4-metylendioxofenyl	
442	OH	3-tetrazolfenyl	
443	OH	3-aminosulfonylfenyl	
444	OH	3-metylamino-sulfonylfenyl	
445	OH	3-etylamino-sulfonylfenyl	
446	OH	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
447	OH	3-metylsulfonylfenyl	
448	OH	4-methoxyfenyl	
449	OH	4-fenylfenyl	
450	OH	(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
451	OH	(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
452	OH	(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
453	OH	(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
454	OH	(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
455	OH	(2-chlorfenyl)-fenyl	
456	OH	(2-fluorfenyl)-fenyl	
457	OH	(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
458	OH	(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	

459	OH	(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
460	OH	(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
461	OH	(2-metylfenyl)-fenyl	
462	OH	(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
463	OH	(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
464	OH	(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
465	OH	(2-formyl-fenyl)-fenyl	
466	OH	(2-amino-fenyl)-fenyl	
467	OH	(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
468	OH	(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
469	OH	(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
470	OH	(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
471	OH	(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
472	OH	(3-metylfenyl)-fenyl	
473	OH	(3-isopropylfenyl)-fenyl	
474	OH	(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
475	OH	(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
476	OH	(3-amino-fenyl)-fenyl	
477	OH	(3-nitro-fenyl)-fenyl	
478	OH	2-pyridyl	
479	OH	3-pyridyl	
480	OH	4-pyridyl	
481	OH	3-amino-4-pyridyl	
482	OH	3-hydroxy-4-pyridyl	
483	OH	3-imidazol	
484	OH	2-nitro-3-imidazol	
485	OH	5-thiazol	
486	OH	5-oxazol	
487	OH	4-pyrazol	
488	OH	fenylethyl	
489	OH	2-aminofenylethyl	
490	OH	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
491	OH	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
492	OH	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
493	OH	2-aminomethylen-fenylethyl	
494	OH	2-tetrazolfenylethyl	
495	OH	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
496	OH	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
497	OH	2-methoxyfenylethyl	
498	OH	3-aminofenylethyl	
499	OH	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
500	OH	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
501	OH	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
502	OH	3-aminomethylen-fenylethyl	
503	OH	3-tetrazolfenylethyl	
504	OH	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
505	OH	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
506	OH	3-methoxyfenylethyl	
507	NH(CO)CH ₃	H	
508	NH(CO)CH ₃	metyl	
509	NH(CO)CH ₃	etyl	
510	NH(CO)CH ₃	n-propyl	
511	NH(CO)CH ₃	n-butyl	
512	NH(CO)CH ₃	n-pentyl	
513	NH(CO)CH ₃	n-hexanyl	
514	NH(CO)CH ₃	n-heptanyl	
515	NH(CO)CH ₃	isopropyl	
516	NH(CO)CH ₃	terc.butyl	

517	NH(CO)CH ₃	cyklopropyl	
518	NH(CO)CH ₃	cyklobutanyl	
519	NH(CO)CH ₃	cyklopentanyl	
520	NH(CO)CH ₃	cyklohexanyl	
521	NH(CO)CH ₃	cykloheptanyl	
522	NH(CO)CH ₃	fenyl	
523	NH(CO)CH ₃	fenylmetyl	
524	NH(CO)CH ₃	3-hydroxyfenyl	
525	NH(CO)CH ₃	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
526	NH(CO)CH ₃	3-fluorfenyl	
527	NH(CO)CH ₃	3-chlorofenyl	
528	NH(CO)CH ₃	3-nitrofenyl	
529	NH(CO)CH ₃	3-aminofenyl	
530	NH(CO)CH ₃	3-metylsufonamidfenyl	
531	NH(CO)CH ₃	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
532	NH(CO)CH ₃	3-Ac-NHfenyl	
533	NH(CO)CH ₃	3-Boc-NHfenyl	
534	NH(CO)CH ₃	3-Cbz-NHfenyl	
535	NH(CO)CH ₃	3-aminometylenfenyl	
536	NH(CO)CH ₃	3-aminoetylenfenyl	
537	NH(CO)CH ₃	3-kyanofenyl	
538	NH(CO)CH ₃	3-kyanometylfenyl	
539	NH(CO)CH ₃	3-hydroxymetylenfenyl	
540	NH(CO)CH ₃	3-karboxyfenyl	
541	NH(CO)CH ₃	3-merkaptofenyl	
542	NH(CO)CH ₃	3-methoxyfenyl	
543	NH(CO)CH ₃	3,4-metylendioxofenyl	
544	NH(CO)CH ₃	3-tetrazolfenyl	
545	NH(CO)CH ₃	3-aminosulfonylfenyl	
546	NH(CO)CH ₃	3-metylamino-sulfonylfenyl	
547	NH(CO)CH ₃	3-etylamino-sulfonylfenyl	
548	NH(CO)CH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
549	NH(CO)CH ₃	3-metylsulfonylfenyl	
550	NH(CO)CH ₃	4-methoxyfenyl	
551	NH(CO)CH ₃	4-fenylfenyl	
552	NH(CO)CH ₃	(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
553	NH(CO)CH ₃	(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
554	NH(CO)CH ₃	(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
555	NH(CO)CH ₃	(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
556	NH(CO)CH ₃	(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
557	NH(CO)CH ₃	(2-chlorfenyl)-fenyl	
558	NH(CO)CH ₃	(2-fluorfenyl)-fenyl	
559	NH(CO)CH ₃	(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
560	NH(CO)CH ₃	(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
561	NH(CO)CH ₃	(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
562	NH(CO)CH ₃	(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
563	NH(CO)CH ₃	(2-metylfenyl)-fenyl	
564	NH(CO)CH ₃	(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
565	NH(CO)CH ₃	(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
566	NH(CO)CH ₃	(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
567	NH(CO)CH ₃	(2-formyl-fenyl)-fenyl	
568	NH(CO)CH ₃	(2-amino-fenyl)-fenyl	
569	NH(CO)CH ₃	(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
570	NH(CO)CH ₃	(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
571	NH(CO)CH ₃	(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
572	NH(CO)CH ₃	(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
573	NH(CO)CH ₃	(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
574	NH(CO)CH ₃	(3-metylfenyl)-fenyl	

575	NH(CO)CH ₃	(3-isopropylfenyl)-fenyl	
576	NH(CO)CH ₃	(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
577	NH(CO)CH ₃	(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
578	NH(CO)CH ₃	(3-amino-fenyl)-fenyl	
579	NH(CO)CH ₃	(3-nitro-fenyl)-fenyl	
580	NH(CO)CH ₃	2-pyridyl	
581	NH(CO)CH ₃	3-pyridyl	
582	NH(CO)CH ₃	4-pyridyl	
583	NH(CO)CH ₃	3-amino-4-pyridyl	
584	NH(CO)CH ₃	3-hydroxy-4-pyridyl	
585	NH(CO)CH ₃	3-imidazol	
586	NH(CO)CH ₃	2-nitro-3-imidazol	
587	NH(CO)CH ₃	5-thiazol	
588	NH(CO)CH ₃	5-oxazol	
589	NH(CO)CH ₃	4-pyrazol	
590	NH(CO)CH ₃	fenylethyl	
591	NH(CO)CH ₃	2-aminofenylethyl	
592	NH(CO)CH ₃	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
593	NH(CO)CH ₃	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
594	NH(CO)CH ₃	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
595	NH(CO)CH ₃	2-aminomethylen-fenylethyl	
596	NH(CO)CH ₃	2-tetrazolfenylethyl	
597	NH(CO)CH ₃	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
598	NH(CO)CH ₃	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
599	NH(CO)CH ₃	2-methoxyfenylethyl	
600	NH(CO)CH ₃	3-aminofenylethyl	
601	NH(CO)CH ₃	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
602	NH(CO)CH ₃	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
603	NH(CO)CH ₃	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
604	NH(CO)CH ₃	3-aminomethylen-fenylethyl	
605	NH(CO)CH ₃	3-tetrazolfenylethyl	
606	NH(CO)CH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
607	NH(CO)CH ₃	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
608	NH(CO)CH ₃	3-methoxyfenylethyl	
609			
610	NH(CO)C ₂ H ₅	H	
611	NH(CO)C ₂ H ₅	metyl	
612	NH(CO)C ₂ H ₅	etyl	
613	NH(CO)C ₂ H ₅	n-propyl	
614	NH(CO)C ₂ H ₅	n-butyl	
615	NH(CO)C ₂ H ₅	n-pentyl	
616	NH(CO)C ₂ H ₅	n-hexanyl	
617	NH(CO)C ₂ H ₅	n-heptanyl	
618	NH(CO)C ₂ H ₅	isopropyl	
619	NH(CO)C ₂ H ₅	terc.butyl	
620	NH(CO)C ₂ H ₅	cyklopropyl	
621	NH(CO)C ₂ H ₅	cyklobutanyl	
622	NH(CO)C ₂ H ₅	cyklopentanyl	
623	NH(CO)C ₂ H ₅	cyklohexanyl	
624	NH(CO)C ₂ H ₅	cykloheptanyl	
625	NH(CO)C ₂ H ₅	fenyl	
626	NH(CO)C ₂ H ₅	fenylmetyl	
627	NH(CO)C ₂ H ₅	3-hydroxyfenyl	
628	NH(CO)C ₂ H ₅	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
629	NH(CO)C ₂ H ₅	3-fluorfenyl	
630	NH(CO)C ₂ H ₅	3-chlorofenyl	
631	NH(CO)C ₂ H ₅	3-nitrofenyl	
632	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminofenyl	

633	NH(CO)C ₂ H ₅	3-metylsufonamidfenyl	
634	NH(CO)C ₂ H ₅	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
635	NH(CO)C ₂ H ₅	3-Ac-NHfenyl	
636	NH(CO)C ₂ H ₅	3-Boc-NHfenyl	
637	NH(CO)C ₂ H ₅	3-Cbz-NHfenyl	
638	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminometylenfenyl	
639	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminoetylenfenyl	
640	NH(CO)C ₂ H ₅	3-kyanofenyl	
641	NH(CO)C ₂ H ₅	3-kyanometylfenyl	
642	NH(CO)C ₂ H ₅	3-hydroxymetylenfenyl	
643	NH(CO)C ₂ H ₅	3-karboxylfenyl	
644	NH(CO)C ₂ H ₅	3-merkaptofenyl	
645	NH(CO)C ₂ H ₅	3-methoxyfenyl	
646	NH(CO)C ₂ H ₅	3,4-metylendioxofenyl	
647	NH(CO)C ₂ H ₅	3-tetrazolfenyl	
648	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminosulfonylfenyl	
649	NH(CO)C ₂ H ₅	3-metylamino-sulfonylfenyl	
650	NH(CO)C ₂ H ₅	3-etylamo-sulfonylfenyl	
651	NH(CO)C ₂ H ₅	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
652	NH(CO)C ₂ H ₅	3-metylsulfonylfenyl	
653	NH(CO)C ₂ H ₅	4-methoxyfenyl	
654	NH(CO)C ₂ H ₅	4-fenylfenyl	
655	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
656	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
657	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
658	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
659	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
660	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
661	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
662	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
663	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
664	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
665	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
666	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
667	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
668	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
669	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
670	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
671	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
672	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
673	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-etylamo-fenyl)-fenyl	
674	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
675	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
676	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
677	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
678	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
679	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
680	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
681	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
682	NH(CO)C ₂ H ₅	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
683	NH(CO)C ₂ H ₅	2-pyridyl	
684	NH(CO)C ₂ H ₅	3-pyridyl	
685	NH(CO)C ₂ H ₅	4-pyridyl	
686	NH(CO)C ₂ H ₅	3-amino-4-pyridyl	
687	NH(CO)C ₂ H ₅	3-hydroxy-4-pyridyl	
688	NH(CO)C ₂ H ₅	3-imidazol	

689	NH(CO)C ₂ H ₅	2-nitro-3-imidazol	
690	NH(CO)C ₂ H ₅	5-thiazol	
691	NH(CO)C ₂ H ₅	5-oxazol	
692	NH(CO)C ₂ H ₅	4-pyrazol	
693	NH(CO)C ₂ H ₅	fenylethyl	
694	NH(CO)C ₂ H ₅	2-aminofenylethyl	
695	NH(CO)C ₂ H ₅	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
696	NH(CO)C ₂ H ₅	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
697	NH(CO)C ₂ H ₅	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
698	NH(CO)C ₂ H ₅	2-aminomethylen-fenylethyl	
699	NH(CO)C ₂ H ₅	2-tetrazolfenylethyl	
700	NH(CO)C ₂ H ₅	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
701	NH(CO)C ₂ H ₅	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
702	NH(CO)C ₂ H ₅	2-methoxyfenylethyl	
703	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminofenylethyl	
704	NH(CO)C ₂ H ₅	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
705	NH(CO)C ₂ H ₅	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
706	NH(CO)C ₂ H ₅	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
707	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminomethylen-fenylethyl	
708	NH(CO)C ₂ H ₅	3-tetrazolfenylethyl	
709	NH(CO)C ₂ H ₅	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
710	NH(CO)C ₂ H ₅	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
711	NH(CO)C ₂ H ₅	3-methoxyfenylethyl	
712	NH(CO)OC ₂ H ₅	H	
713	NH(CO)OC ₂ H ₅	metyl	
714	NH(CO)OC ₂ H ₅	etyl	
715	NH(CO)OC ₂ H ₅	n-propyl	
716	NH(CO)OC ₂ H ₅	n-butyl	
717	NH(CO)OC ₂ H ₅	n-pentyl	
718	NH(CO)OC ₂ H ₅	n-hexanyl	
719	NH(CO)OC ₂ H ₅	n-heptanyl	
720	NH(CO)OC ₂ H ₅	isopropyl	
721	NH(CO)OC ₂ H ₅	terc.butyl	
722	NH(CO)OC ₂ H ₅	cyklopropyl	
723	NH(CO)OC ₂ H ₅	cyklobutanyl	
724	NH(CO)OC ₂ H ₅	cyklopentanyl	
725	NH(CO)OC ₂ H ₅	cyklohexanyl	
726	NH(CO)OC ₂ H ₅	cykloheptanyl	
727	NH(CO)OC ₂ H ₅	fenyl	
728	NH(CO)OC ₂ H ₅	fenylmetyl	
729	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-hydroxyfenyl	
730	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
731	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-fluorfenyl	
732	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-chlorofenyl	
733	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-nitrofenyl	
734	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminofenyl	
735	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-metylsufonamidfenyl	
736	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
737	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-Ac-NHfenyl	
738	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-Boc-NHfenyl	
739	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-Cbz-NHfenyl	
740	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminometylenfenyl	
741	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminoetylenfenyl	
742	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-kyanofenyl	
743	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-kyanometylfenyl	
744	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-hydroxymetylenfenyl	
745	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-karboxylfenyl	
746	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-merkaptofenyl	

747	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-methoxyfenyl	
748	NH(CO)OC ₂ H ₅	3,4-metylendioxofenyl	
749	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-tetrazolfenyl	
750	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminosulfonylfenyl	
751	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-metylamino-sulfonylfenyl	
752	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-etylamo-sulfonylfenyl	
753	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
754	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-metylsulfonylfenyl	
755	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-methoxyfenyl	
756	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-fenylfenyl	
757	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
758	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
759	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
760	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
761	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
762	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
763	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
764	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
765	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
766	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
767	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
768	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
769	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
770	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
771	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
772	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
773	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
774	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
775	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-etylamo-fenyl)-fenyl	
776	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
777	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
778	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
779	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
780	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
781	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
782	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
783	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
784	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
785	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-pyridyl	
786	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-pyridyl	
787	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-pyridyl	
788	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-amino-4-pyridyl	
789	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-hydroxy-4-pyridyl	
790	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-imidazol	
791	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-nitro-3-imidazol	
792	NH(CO)OC ₂ H ₅	5-thiazol	
793	NH(CO)OC ₂ H ₅	5-oxazol	
794	NH(CO)OC ₂ H ₅	4-pyrazol	
795	NH(CO)OC ₂ H ₅	fenylethyl	
796	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-aminofenylethyl	
797	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
798	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
799	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
800	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-aminomethylen-fenylethyl	
801	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-tetrazolfenylethyl	
802	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	

803	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
804	NH(CO)OC ₂ H ₅	2-methoxyfenylethyl	
805	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminofenylethyl	
806	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
807	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
808	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
809	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminomethylen-fenylethyl	
810	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-tetrazolfenylethyl	
811	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
812	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
813	NH(CO)OC ₂ H ₅	3-methoxyfenylethyl	
814	NH(CO)OCH ₃	H	
815	NH(CO)OCH ₃	metyl	
816	NH(CO)OCH ₃	etyl	
817	NH(CO)OCH ₃	n-propyl	
818	NH(CO)OCH ₃	n-butyl	
819	NH(CO)OCH ₃	n-pentyl	
820	NH(CO)OCH ₃	n-hexanyl	
821	NH(CO)OCH ₃	n-heptanyl	
822	NH(CO)OCH ₃	isopropyl	
823	NH(CO)OCH ₃	terc.butyl	
824	NH(CO)OCH ₃	cyklopropyl	
825	NH(CO)OCH ₃	cyklobutanyl	
826	NH(CO)OCH ₃	cyklopentanyl	
827	NH(CO)OCH ₃	cyklohexanyl	
828	NH(CO)OCH ₃	cykloheptanyl	
829	NH(CO)OCH ₃	fenyl	
830	NH(CO)OCH ₃	fenylmetyl	
831	NH(CO)OCH ₃	3-hydroxyfenyl	
832	NH(CO)OCH ₃	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
833	NH(CO)OCH ₃	3-fluorfenyl	
834	NH(CO)OCH ₃	3-chlorofenyl	
835	NH(CO)OCH ₃	3-nitrofenyl	
836	NH(CO)OCH ₃	3-aminofenyl	
837	NH(CO)OCH ₃	3-metylsufonamidfenyl	
838	NH(CO)OCH ₃	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
839	NH(CO)OCH ₃	3-Ac-NHfenyl	
840	NH(CO)OCH ₃	3-Boc-NHfenyl	
841	NH(CO)OCH ₃	3-Cbz-NHfenyl	
842	NH(CO)OCH ₃	3-aminometylenfenyl	
843	NH(CO)OCH ₃	3-aminoetylenfenyl	
844	NH(CO)OCH ₃	3-kyanofenyl	
845	NH(CO)OCH ₃	3-kyanometylfenyl	
846	NH(CO)OCH ₃	3-hydroxymetylenfenyl	
847	NH(CO)OCH ₃	3-karboxylfenyl	
848	NH(CO)OCH ₃	3-merkaptofenyl	
849	NH(CO)OCH ₃	3-methoxyfenyl	
850	NH(CO)OCH ₃	3,4-metylendioxofenyl	
851	NH(CO)OCH ₃	3-tetrazolfenyl	
852	NH(CO)OCH ₃	3-aminosulfonylfenyl	
853	NH(CO)OCH ₃	3-metylamino-sulfonylfenyl	
854	NH(CO)OCH ₃	3-etylamino-sulfonylfenyl	
855	NH(CO)OCH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
856	NH(CO)OCH ₃	3-metylsulfonylfenyl	
857	NH(CO)OCH ₃	4-methoxyfenyl	
858	NH(CO)OCH ₃	4-fenylfenyl	
859	NH(CO)OCH ₃	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
860	NH(CO)OCH ₃	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	

861	NH(CO)OCH ₃	4-(2-methylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
862	NH(CO)OCH ₃	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
863	NH(CO)OCH ₃	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
864	NH(CO)OCH ₃	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
865	NH(CO)OCH ₃	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
866	NH(CO)OCH ₃	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
867	NH(CO)OCH ₃	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
868	NH(CO)OCH ₃	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
869	NH(CO)OCH ₃	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
870	NH(CO)OCH ₃	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
871	NH(CO)OCH ₃	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
872	NH(CO)OCH ₃	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
873	NH(CO)OCH ₃	4-(2-trmetyl-fenyl)-fenyl	
874	NH(CO)OCH ₃	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
875	NH(CO)OCH ₃	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
876	NH(CO)OCH ₃	4-(2-methylamino-fenyl)-fenyl	
877	NH(CO)OCH ₃	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
878	NH(CO)OCH ₃	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
879	NH(CO)OCH ₃	4-(2-metylsulfonilamino-fenyl)-fenyl	
880	NH(CO)OCH ₃	4-(2-trifluormetyl-sulfonil-amino-fenyl)-fenyl	
881	NH(CO)OCH ₃	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
882	NH(CO)OCH ₃	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
883	NH(CO)OCH ₃	4-(3-trifluormetyl-sulfonil-amino-fenyl)-fenyl	
884	NH(CO)OCH ₃	4-(3-methylsulfonilamino-fenyl)-fenyl	
885	NH(CO)OCH ₃	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
886	NH(CO)OCH ₃	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
887	NH(CO)OCH ₃	2-pyridyl	
888	NH(CO)OCH ₃	3-pyridyl	
889	NH(CO)OCH ₃	4-pyridyl	
890	NH(CO)OCH ₃	3-amino-4-pyridyl	
891	NH(CO)OCH ₃	3-hydroxy-4-pyridyl	
892	NH(CO)OCH ₃	3-imidazol	
893	NH(CO)OCH ₃	2-nitro-3-imidazol	
894	NH(CO)OCH ₃	5-thiazol	
895	NH(CO)OCH ₃	5-oxazol	
896	NH(CO)OCH ₃	4-pyrazol	
897	NH(CO)OCH ₃	fenylethyl	
898	NH(CO)OCH ₃	2-aminofenylethyl	
899	NH(CO)OCH ₃	2-methylsulfonilamino-fenylethyl	
900	NH(CO)OCH ₃	2-trifluormethylsulfonilamino-fenylethyl	
901	NH(CO)OCH ₃	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
902	NH(CO)OCH ₃	2-aminomethylen-fenylethyl	
903	NH(CO)OCH ₃	2-tetrazolfenylethyl	
904	NH(CO)OCH ₃	2-terc.-butylamino-sulfonilfenylethyl	
905	NH(CO)OCH ₃	2-aminosulfonil-fenylethyl	
906	NH(CO)OCH ₃	2-methoxyfenylethyl	
907	NH(CO)OCH ₃	3-aminofenylethyl	
908	NH(CO)OCH ₃	3-methylsulfonilamino-fenylethyl	
909	NH(CO)OCH ₃	3-trifluormethylsulfonilamino-fenylethyl	
910	NH(CO)OCH ₃	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
911	NH(CO)OCH ₃	3-aminomethylen-fenylethyl	
912	NH(CO)OCH ₃	3-tetrazolfenylethyl	
913	NH(CO)OCH ₃	3-terc.butylamino-sulfonilfenylethyl	
914	NH(CO)OCH ₃	3-aminosulfonil-fenylethyl	
915	NH(CO)OCH ₃	3-methoxyfenylethyl	
916	NHBOC	H	

917	NHBOC	metyl	
918	NHBOC	etyl	
919	NHBOC	n-propyl	
920	NHBOC	n-butyl	
921	NHBOC	n-pentyl	
922	NHBOC	n-hexanyl	
923	NHBOC	n-heptanyl	
924	NHBOC	isopropyl	
925	NHBOC	terc.butyl	
926	NHBOC	cyklopropyl	
927	NHBOC	cyklobutanyl	
928	NHBOC	cyklopentanyl	
929	NHBOC	cyklohexanyl	
930	NHBOC	cykloheptanyl	
931	NHBOC	fenyl	
932	NHBOC	fenylmetyl	
933	NHBOC	3-hydroxyfenyl	
934	NHBOC	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
935	NHBOC	3-fluorfenyl	
936	NHBOC	3-chlorofenyl	
937	NHBOC	3-nitrofenyl	
938	NHBOC	3-aminofenyl	
939	NHBOC	3-metylsufonamidfenyl	
940	NHBOC	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
941	NHBOC	3-Ac-NHfenyl	
942	NHBOC	3-Boc-NHfenyl	
943	NHBOC	3-Cbz-NHfenyl	
944	NHBOC	3-aminometylenfenyl	
945	NHBOC	3-aminoetylenfenyl	
946	NHBOC	3-kyanofenyl	
947	NHBOC	3-kyanometylfenyl	
948	NHBOC	3-hydroxymetylenfenyl	
949	NHBOC	3-karboxyfenyl	
950	NHBOC	3-merkaptofenyl	
951	NHBOC	3-methoxyfenyl	
952	NHBOC	3,4-metylendioxofenyl	
953	NHBOC	3-tetrazolfenyl	
954	NHBOC	3-aminosulfonylfenyl	
955	NHBOC	3-metylamino-sulfonylfenyl	
956	NHBOC	3-etylamino-sulfonylfenyl	
957	NHBOC	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
958	NHBOC	3-metylsulfonylfenyl .	
959	NHBOC	4-methoxyfenyl	
960	NHBOC	4-fenylnfenyl	
961	NHBOC	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
962	NHBOC	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
963	NHBOC	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
964	NHBOC	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
965	NHBOC	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
966	NHBOC	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
967	NHBOC	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
968	NHBOC	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
969	NHBOC	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
970	NHBOC	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
971	NHBOC	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
972	NHBOC	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
973	NHBOC	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
974	NHBOC	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	

975	NHBOC	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
976	NHBOC	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
977	NHBOC	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
978	NHBOC	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
979	NHBOC	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
980	NHBOC	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
981	NHBOC	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
982	NHBOC	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
983	NHBOC	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
984	NHBOC	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
985	NHBOC	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
986	NHBOC	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
987	NHBOC	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
988	NHBOC	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
989	NHBOC	2-pyridyl	
990	NHBOC	3-pyridyl	
991	NHBOC	4-pyridyl	
992	NHBOC	3-amino-4-pyridyl	
993	NHBOC	3-hydroxy-4-pyridyl	
994	NHBOC	3-imidazol	
995	NHBOC	2-nitro-3-imidazol	
996	NHBOC	5-thiazol	
997	NHBOC	5-oxazol	
998	NHBOC	4-pyrazol	
999	NHBOC	fenylethyl	
1000	NHBOC	2-aminofenylethyl	
1001	NHBOC	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1002	NHBOC	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1003	NHBOC	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1004	NHBOC	2-aminomethylen-fenylethyl	
1005	NHBOC	2-tetrazolfenylethyl	
1006	NHBOC	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1007	NHBOC	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1008	NHBOC	2-methoxyfenylethyl	
1009	NHBOC	3-aminofenylethyl	
1010	NHBOC	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1011	NHBOC	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1012	NHBOC	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1013	NHBOC	3-aminomethylen-fenylethyl	
1014	NHBOC	3-tetrazolfenylethyl	
1015	NHBOC	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1016	NHBOC	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1017	NHBOC	3-methoxyfenylethyl	
1018	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	H	
1019	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	metyl	
1020	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	etyl	
1021	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	n-propyl	
1022	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	n-butyl	
1023	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	n-pentyl	
1024	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	n-hexanyl	
1025	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	n-heptanyl	
1026	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	isopropyl	
1027	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	terc. butyl	
1028	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	cyklopropyl	
1029	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	cyklobutanyl	
1030	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	cyklopentanyl	

1031	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	cyklohexanyl	
1032	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	cykloheptanyl	
1033	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	fenyl	
1034	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	fenylmetyl	
1035	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-hydroxyfenyl	
1936	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1037	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-fluorfenyl	
1038	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-chlorofenyl	
1039	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-nitrofenyl	
1040	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminofenyl	
1041	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-metylsufonamidfenyl	
1042	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1043	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-Ac-NHfenyl	
1044	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-Boc-NHfenyl	
1045	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-Cbz-NHfenyl	
1046	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminometylenfenyl	
1047	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminoetylenfenyl	
1048	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-kyanofenyl	
1049	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-kyanometylfenyl	
1050	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-hydroxymetylenfenyl	
1051	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-karboxylfenyl	
1052	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-merkaptofenyl	
1053	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-methoxyfenyl	
1054	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3,4-metylendioxofenyl	
1055	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-tetrazolfenyl	
1056	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminosulfonylfenyl	
1057	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1058	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1059	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1060	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-metylsulfonylfenyl	
1061	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-methoxyfenyl	
1062	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-fenylfenyl	
1063	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1064	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1065	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1066	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1067	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
1068	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1069	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1070	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1071	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1072	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1073	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1074	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1075	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1076	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1077	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1078	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1079	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1080	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1081	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1082	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1083	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1084	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1085	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1086	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1087	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-	

		fenyl	
1088	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1089	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1090	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1091	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-pyridyl	
1092	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-pyridyl	
1093	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-pyridyl	
1094	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-amino-4-pyridyl	
1095	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-hydroxy-4-pyridyl	
1096	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-imidazol	
1097	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-nitro-3-imidazol	
1098	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	5-thiazol	
1099	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	5-oxazol	
1100	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	4-pyrazol	
1101	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	fenylethyl	
1102	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-aminofenylethyl	
1103	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1104	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1105	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1106	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-aminomethylen-fenylethyl	
1107	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-tetrazolfenylethyl	
1108	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1109	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1110	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	2-methoxyfenylethyl	
1111	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminofenylethyl	
1112	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1113	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1114	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1115	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminomethylen-fenylethyl	
1116	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-tetrazolfenylethyl	
1117	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1118	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1119	NH(CO)OCH ₂ -4-pyridyl	3-methoxyfenylethyl	
1120	NHS(O ₂)CH ₃	H	
1121	NHS(O ₂)CH ₃	metyl	
1122	NHS(O ₂)CH ₃	etyl	
1123	NHS(O ₂)CH ₃	n-propyl	
1124	NHS(O ₂)CH ₃	n-butyl	
1125	NHS(O ₂)CH ₃	n-pentyl	
1126	NHS(O ₂)CH ₃	n-hexanyl	
1127	NHS(O ₂)CH ₃	n-heptanyl	
1128	NHS(O ₂)CH ₃	isopropyl	
1129	NHS(O ₂)CH ₃	terc.butyl	
1130	NHS(O ₂)CH ₃	cyklopropyl	
1131	NHS(O ₂)CH ₃	cyklobutanyl	
1132	NHS(O ₂)CH ₃	cyklopentanyl	
1133	NHS(O ₂)CH ₃	cyklohexanyl	
1134	NHS(O ₂)CH ₃	cykloheptanyl	
1135	NHS(O ₂)CH ₃	fenyl	
1136	NHS(O ₂)CH ₃	fenylmetyl	
1137	NHS(O ₂)CH ₃	3-hydroxyfenyl	
1138	NHS(O ₂)CH ₃	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1139	NHS(O ₂)CH ₃	3-fluorfenyl	
1140	NHS(O ₂)CH ₃	3-chlorofenyl	
1141	NHS(O ₂)CH ₃	3-nitrofenyl	
1142	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminofenyl	
1143	NHS(O ₂)CH ₃	3-metylsufonamidfenyl	
1144	NHS(O ₂)CH ₃	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	

1145	NHS(O ₂)CH ₃	3-Ac-NHfenyl	
1146	NHS(O ₂)CH ₃	3-Boc-NHfenyl	
1147	NHS(O ₂)CH ₃	3-Cbz-NHfenyl	
1148	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminometylenfenyl	
1149	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminoetylenfenyl	
1150	NHS(O ₂)CH ₃	3-kyanofenyl	
1151	NHS(O ₂)CH ₃	3-kyanometylfenyl	
1152	NHS(O ₂)CH ₃	3-hydroxymetylenfenyl	
1153	NHS(O ₂)CH ₃	3-karboxylfenyl	
1154	NHS(O ₂)CH ₃	3-merkaptofenyl	
1155	NHS(O ₂)CH ₃	3-methoxyfenyl	
1156	NHS(O ₂)CH ₃	3,4-metylendioxofenyl	
1157	NHS(O ₂)CH ₃	3-tetrazolfenyl	
1158	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminosulfonylfenyl	
1159	NHS(O ₂)CH ₃	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1160	NHS(O ₂)CH ₃	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1161	NHS(O ₂)CH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1162	NHS(O ₂)CH ₃	3-metylsulfonylfenyl	
1163	NHS(O ₂)CH ₃	4-methoxyfenyl	
1164	NHS(O ₂)CH ₃	4-fenylfenyl	
1165	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1166	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1167	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1168	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1169	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1170	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1171	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1172	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1173	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1174	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1175	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1176	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1177	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1178	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1179	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1180	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1181	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1182	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1183	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1184	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1185	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1186	NHS(O ₂)CH ₃	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1187	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1188	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1189	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1190	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1191	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1192	NHS(O ₂)CH ₃	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1193	NHS(O ₂)CH ₃	2-pyridyl	
1194	NHS(O ₂)CH ₃	3-pyridyl	
1195	NHS(O ₂)CH ₃	4-pyridyl	
1196	NHS(O ₂)CH ₃	3-amino-4-pyridyl	
1197	NHS(O ₂)CH ₃	3-hydroxy-4-pyridyl	
1198	NHS(O ₂)CH ₃	3-imidazol	
1199	NHS(O ₂)CH ₃	2-nitro-3-imidazol	
1200	NHS(O ₂)CH ₃	5-thiazol	

1201	NHS(O ₂)CH ₃	5-oxazol	
1202	NHS(O ₂)CH ₃	4-pyrazol	
1203	NHS(O ₂)CH ₃	fenylethyl	
1204	NHS(O ₂)CH ₃	2-aminofenylethyl	
1205	NHS(O ₂)CH ₃	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1206	NHS(O ₂)CH ₃	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1207	NHS(O ₂)CH ₃	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1208	NHS(O ₂)CH ₃	2-aminomethylen-fenylethyl	
1209	NHS(O ₂)CH ₃	2-tetrazolfenylethyl	
1210	NHS(O ₂)CH ₃	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1211	NHS(O ₂)CH ₃	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1212	NHS(O ₂)CH ₃	2-methoxyfenylethyl	
1213	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminofenylethyl	
1214	NHS(O ₂)CH ₃	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1215	NHS(O ₂)CH ₃	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1216	NHS(O ₂)CH ₃	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1217	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminomethylen-fenylethyl	
1218	NHS(O ₂)CH ₃	3-tetrazolfenylethyl	
1219	NHS(O ₂)CH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1220	NHS(O ₂)CH ₃	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1221	NHS(O ₂)CH ₃	3-methoxyfenylethyl	
1222	NHS(O ₂)CF ₃	H	
1223	NHS(O ₂)CF ₃	metyl	
1224	NHS(O ₂)CF ₃	etyl	
1225	NHS(O ₂)CF ₃	n-propyl	
1226	NHS(O ₂)CF ₃	n-butyl	
1227	NHS(O ₂)CF ₃	n-pentyl	
1228	NHS(O ₂)CF ₃	n-hexanyl	
1229	NHS(O ₂)CF ₃	n-heptanyl	
1230	NHS(O ₂)CF ₃	isopropyl	
1231	NHS(O ₂)CF ₃	terc.butyl	
1232	NHS(O ₂)CF ₃	cyklopropyl	
1233	NHS(O ₂)CF ₃	cyklobutanyl	
1234	NHS(O ₂)CF ₃	cyklopentanyl	
1235	NHS(O ₂)CF ₃	cyklohexanyl	
1236	NHS(O ₂)CF ₃	cykloheptanyl	
1237	NHS(O ₂)CF ₃	fenyl	
1238	NHS(O ₂)CF ₃	fenylmetyl	
1239	NHS(O ₂)CF ₃	3-hydroxyfenyl	
1240	NHS(O ₂)CF ₃	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1241	NHS(O ₂)CF ₃	3-fluorfenyl	
1242	NHS(O ₂)CF ₃	3-chlorofenyl	
1243	NHS(O ₂)CF ₃	3-nitrofenyl	
1244	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminofenyl	
1245	NHS(O ₂)CF ₃	3-metylsufonamidfenyl	
1246	NHS(O ₂)CF ₃	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1247	NHS(O ₂)CF ₃	3-Ac-NHfenyl	
1248	NHS(O ₂)CF ₃	3-Boc-NHfenyl	
1249	NHS(O ₂)CF ₃	3-Cbz-NHfenyl	
1250	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminometylenfenyl	
1251	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminoetylenfenyl	
1252	NHS(O ₂)CF ₃	3-kyanofenyl	
1253	NHS(O ₂)CF ₃	3-kyanometylfenyl	
1254	NHS(O ₂)CF ₃	3-hydroxymetylenfenyl	
1255	NHS(O ₂)CF ₃	3-karboxyfenyl	
1256	NHS(O ₂)CF ₃	3-merkaptofenyl	
1257	NHS(O ₂)CF ₃	3-methoxyfenyl	
1258	NHS(O ₂)CF ₃	3,4-metylendioxofenyl	

1259	NHS(O ₂)CF ₃	3-tetrazolfenyl	
1260	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminosulfonylphenyl	
1261	NHS(O ₂)CF ₃	3-methylamino-sulfonylphenyl	
1262	NHS(O ₂)CF ₃	3-ethylamino-sulfonylphenyl	
1263	NHS(O ₂)CF ₃	3-terc.butylamino-sulfonylphenyl	
1264	NHS(O ₂)CF ₃	3-methylsulfonylphenyl	
1265	NHS(O ₂)CF ₃	4-methoxyphenyl	
1266	NHS(O ₂)CF ₃	4-phenylphenyl	
1267	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-hydroxy-methylenphenyl)-phenyl	
1268	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-terc.butylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
1269	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
1270	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-ethylamino-sulfonylphenyl)-phenyl	
1271	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-amino-sulfonylphenyl)-phenyl	
1272	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-chlorophenyl)-phenyl	
1273	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-fluorophenyl)-phenyl	
1274	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2,4-dichlorophenyl)-phenyl	
1275	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2,6-dichlorophenyl)-phenyl	
1276	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3,5-dichlorophenyl)-phenyl	
1277	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2,3-dichlorophenyl)-phenyl	
1278	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methylphenyl)-phenyl	
1279	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-tetrazol-phenyl)-phenyl	
1280	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methoxy-phenyl)-phenyl	
1281	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methyl-phenyl)-phenyl	
1282	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-formyl-phenyl)-phenyl	
1283	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-amino-phenyl)-phenyl	
1284	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methylamino-phenyl)-phenyl	
1285	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-ethylamino-phenyl)-phenyl	
1286	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-propylamino-phenyl)-phenyl	
1287	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
1288	NHS(O ₂)CF ₃	4-(2-trifluormethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
1289	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-methylphenyl)-phenyl	
1290	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-isopropylphenyl)-phenyl	
1291	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-trifluormethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
1292	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
1293	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-amino-phenyl)-phenyl	
1294	NHS(O ₂)CF ₃	4-(3-nitro-phenyl)-phenyl	
1295	NHS(O ₂)CF ₃	2-pyridyl	
1296	NHS(O ₂)CF ₃	3-pyridyl	
1297	NHS(O ₂)CF ₃	4-pyridyl	
1298	NHS(O ₂)CF ₃	3-amino-4-pyridyl	
1299	NHS(O ₂)CF ₃	3-hydroxy-4-pyridyl	
1300	NHS(O ₂)CF ₃	3-imidazol	
1301	NHS(O ₂)CF ₃	2-nitro-3-imidazol	
1302	NHS(O ₂)CF ₃	5-thiazol	
1303	NHS(O ₂)CF ₃	5-oxazol	
1304	NHS(O ₂)CF ₃	4-pyrazol	
1305	NHS(O ₂)CF ₃	fenylethyl	
1306	NHS(O ₂)CF ₃	2-aminofenylethyl	
1307	NHS(O ₂)CF ₃	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1308	NHS(O ₂)CF ₃	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1309	NHS(O ₂)CF ₃	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1310	NHS(O ₂)CF ₃	2-aminomethylen-fenylethyl	
1311	NHS(O ₂)CF ₃	2-tetrazolfenylethyl	
1312	NHS(O ₂)CF ₃	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1313	NHS(O ₂)CF ₃	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1314	NHS(O ₂)CF ₃	2-methoxyfenylethyl	

1315	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminofenylethyl	
1316	NHS(O ₂)CF ₃	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1317	NHS(O ₂)CF ₃	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1318	NHS(O ₂)CF ₃	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1319	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminomethylen-fenylethyl	
1320	NHS(O ₂)CF ₃	3-tetrazolfenylethyl	
1321	NHS(O ₂)CF ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1322	NHS(O ₂)CF ₃	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1323	NHS(O ₂)CF ₃	3-methoxyfenylethyl	
1324	4-aminofenylS(O) ₂ NH	H	
1325	4-aminofenylS(O) ₂ NH	metyl	
1326	4-aminofenylS(O) ₂ NH	etyl	
1327	4-aminofenylS(O) ₂ NH	n-propyl	
1328	4-aminofenylS(O) ₂ NH	n-butyl	
1329	4-aminofenylS(O) ₂ NH	n-pentyl	
1330	4-aminofenylS(O) ₂ NH	n-hexanyl	
1331	4-aminofenylS(O) ₂ NH	n-heptanyl	
1332	4-aminofenylS(O) ₂ NH	isopropyl	
1333	4-aminofenylS(O) ₂ NH	terc.butyl	
1334	4-aminofenylS(O) ₂ NH	cyklopropyl	
1335	4-aminofenylS(O) ₂ NH	cyklobutanyl	
1336	4-aminofenylS(O) ₂ NH	cyklopentanyl	
1337	4-aminofenylS(O) ₂ NH	cyklohexanyl	
1338	4-aminofenylS(O) ₂ NH	cykloheptanyl	
1339	4-aminofenylS(O) ₂ NH	fenyl	
1340	4-aminofenylS(O) ₂ NH	fenylmetyl	
1341	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-hydroxyfenyl	
1342	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1343	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-fluorfenyl	
1344	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-chlorfenyl	
1345	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-nitrofenyl	
1346	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminofenyl	
1347	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-metylsufonamidfenyl	
1348	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1349	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-Ac-NHfenyl	
1350	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-Boc-NHfenyl	
1351	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-Cbz-NHfenyl	
1352	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminometylenfenyl	
1353	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminoetylenfenyl	
1354	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-kyanofenyl	
1355	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-kyanometylfenyl	
1356	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-hydroxymetylenfenyl	
1357	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-karboxylfenyl	
1358	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-merkaptofenyl	
1359	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-methoxyfenyl	
1360	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3,4-metylendioxofenyl	
1361	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-tetrazolfenyl	
1362	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminosulfonylfenyl	
1363	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1364	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1365	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1366	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-metylsulfonylfenyl	
1367	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-methoxyfenyl	
1368	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-fenylfenyl	
1369	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1370	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1371	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1372	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	

1373	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
1374	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1375	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1376	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1377	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1378	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1379	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1380	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1381	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1382	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1383	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1384	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1385	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1386	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1387	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1388	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1389	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1390	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1391	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1392	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1393	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1394	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1395	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1396	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1397	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-pyridyl	
1398	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-pyridyl	
1399	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-pyridyl	
1400	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-amino-4-pyridyl	
1401	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-hydroxy-4-pyridyl	
1402	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-imidazol	
1403	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-nitro-3-imidazol	
1404	4-aminofenylS(O) ₂ NH	5-thiazol	
1405	4-aminofenylS(O) ₂ NH	5-oxazol	
1406	4-aminofenylS(O) ₂ NH	4-pyrazol	
1407	4-aminofenylS(O) ₂ NH	fenylethyl	
1408	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-aminofenylethyl	
1409	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1410	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1411	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1412	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-aminomethylen-fenylethyl	
1413	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-tetrazolfenylethyl	
1414	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1415	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1416	4-aminofenylS(O) ₂ NH	2-methoxyfenylethyl	
1417	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminofenylethyl	
1418	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1419	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1420	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1421	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminomethylen-fenylethyl	
1422	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-tetrazolfenylethyl	
1423	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1424	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1425	4-aminofenylS(O) ₂ NH	3-methoxyfenylethyl	
1426	NH(CO)NMe ₂	H	
1427	NH(CO)NMe ₂	metyl	
1428	NH(CO)NMe ₂	etyl	

1429	NH(CO)NMe ₂	n-propyl	
1430	NH(CO)NMe ₂	n-butyl	
1431	NH(CO)NMe ₂	n-pentyl	
1432	NH(CO)NMe ₂	n-hexanyl	
1433	NH(CO)NMe ₂	n-heptanyl	
1434	NH(CO)NMe ₂	isopropyl	
1435	NH(CO)NMe ₂	terc.butyl	
1436	NH(CO)NMe ₂	cyklopropyl	
1437	NH(CO)NMe ₂	cyklobutanyl	
1438	NH(CO)NMe ₂	cyklopentanyl	
1439	NH(CO)NMe ₂	cyklohexanyl	
1440	NH(CO)NMe ₂	cykloheptanyl	
1441	NH(CO)NMe ₂	fenyl	
1442	NH(CO)NMe ₂	fenylmetyl	
1443	NH(CO)NMe ₂	3-hydroxyfenyl	
1444	NH(CO)NMe ₂	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1445	NH(CO)NMe ₂	3-fluorfenyl	
1446	NH(CO)NMe ₂	3-chlorfenyl	
1447	NH(CO)NMe ₂	3-nitrofenyl	
1448	NH(CO)NMe ₂	3-aminofenyl	
1449	NH(CO)NMe ₂	3-metylsufonamidfenyl	
1450	NH(CO)NMe ₂	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1451	NH(CO)NMe ₂	3-Ac-NHfenyl	
1452	NH(CO)NMe ₂	3-Boc-NHfenyl	
1453	NH(CO)NMe ₂	3-Cbz-NHfenyl	
1454	NH(CO)NMe ₂	3-aminometylenfenyl	
1455	NH(CO)NMe ₂	3-aminoetylenfenyl	
1456	NH(CO)NMe ₂	3-kyanofenyl	
1457	NH(CO)NMe ₂	3-kyanometylfenyl	
1458	NH(CO)NMe ₂	3-hydroxymetylenfenyl	
1459	NH(CO)NMe ₂	3-karboxyfenyl	
1460	NH(CO)NMe ₂	3-merkaptofenyl	
1461	NH(CO)NMe ₂	3-methoxyfenyl	
1462	NH(CO)NMe ₂	3,4-metylendioxofenyl	
1463	NH(CO)NMe ₂	3-tetrazolfenyl	
1464	NH(CO)NMe ₂	3-aminosulfonylfenyl	
1465	NH(CO)NMe ₂	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1466	NH(CO)NMe ₂	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1467	NH(CO)NMe ₂	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1468	NH(CO)NMe ₂	3-metylsulfonylfenyl	
1469	NH(CO)NMe ₂	4-methoxyfenyl	
1470	NH(CO)NMe ₂	4-fenylfenyl	
1471	NH(CO)NMe ₂	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1472	NH(CO)NMe ₂	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1473	NH(CO)NMe ₂	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1474	NH(CO)NMe ₂	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1475	NH(CO)NMe ₂	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1476	NH(CO)NMe ₂	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1477	NH(CO)NMe ₂	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1478	NH(CO)NMe ₂	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1479	NH(CO)NMe ₂	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1480	NH(CO)NMe ₂	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1481	NH(CO)NMe ₂	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1482	NH(CO)NMe ₂	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1483	NH(CO)NMe ₂	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1484	NH(CO)NMe ₂	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1485	NH(CO)NMe ₂	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1486	NH(CO)NMe ₂	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	

1487	NH(CO)NMe ₂	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1488	NH(CO)NMe ₂	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1489	NH(CO)NMe ₂	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1490	NH(CO)NMe ₂	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1491	NH(CO)NMe ₂	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1492	NH(CO)NMe ₂	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1493	NH(CO)NMe ₂	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1494	NH(CO)NMe ₂	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1495	NH(CO)NMe ₂	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1496	NH(CO)NMe ₂	4-(3-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1497	NH(CO)NMe ₂	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1498	NH(CO)NMe ₂	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1499	NH(CO)NMe ₂	2-pyridyl	
1500	NH(CO)NMe ₂	3-pyridyl	
1501	NH(CO)NMe ₂	4-pyridyl	
1502	NH(CO)NMe ₂	3-amino-4-pyridyl	
1503	NH(CO)NMe ₂	3-hydroxy-4-pyridyl	
1504	NH(CO)NMe ₂	2-imidazol	
1505	NH(CO)NMe ₂	2-nitro-3-imidazol	
1506	NH(CO)NMe ₂	5-thiazol	
1507	NH(CO)NMe ₂	5-oxazol	
1508	NH(CO)NMe ₂	4-pyrazol	
1509	NH(CO)NMe ₂	fenylethyl	
1510	NH(CO)NMe ₂	2-aminofenylethyl	
1511	NH(CO)NMe ₂	2-metylsulfonylamino-fenylethyl	
1512	NH(CO)NMe ₂	2-trifluormetylsulfonylamino-fenylethyl	
1513	NH(CO)NMe ₂	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1514	NH(CO)NMe ₂	2-aminomethylen-fenylethyl	
1515	NH(CO)NMe ₂	2-tetrazolfenylethyl	
1516	NH(CO)NMe ₂	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1517	NH(CO)NMe ₂	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1518	NH(CO)NMe ₂	2-methoxyfenylethyl	
1519	NH(CO)NMe ₂	3-aminofenylethyl	
1520	NH(CO)NMe ₂	3-metylsulfonylamino-fenylethyl	
1521	NH(CO)NMe ₂	3-trifluormetylsulfonylamino-fenylethyl	
1522	NH(CO)NMe ₂	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1523	NH(CO)NMe ₂	3-aminomethylen-fenylethyl	
1524	NH(CO)NMe ₂	3-tetrazolfenylethyl	
1525	NH(CO)NMe ₂	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1526	NH(CO)NMe ₂	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1527	NH(CO)NMe ₂	3-methoxyfenylethyl	
1528	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	H	
1529	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	metyl	
1530	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	etyl	
1531	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	n-propyl	
1532	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	n-butyl	
1533	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	n-pentyl	
1534	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	n-hexanyl	
1535	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	n-heptanyl	
1536	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	isopropyl	
1537	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	terc.butyl	
1538	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	cyklopropyl	
1539	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	cyklobutanyl	
1540	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	cyklopentanyl	
1541	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	cyklohexanyl	
1542	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	cykloheptanyl	

1543	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	fenyl	
1544	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	fenylmetyl	
1545	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-hydroxyfenyl	
1546	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1547	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-fluorfenyl	
1548	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-chlorfenyl	
1549	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-nitrofenyl	
1550	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminofenyl	
1551	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-metylsufonamidfenyl	
1552	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1553	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-Ac-NHfenyl	
1554	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-Boc-NHfenyl	
1555	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-Cbz-NHfenyl	
1556	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminometylenfenyl	
1557	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminoetylenfenyl	
1558	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-kyanofenyl	
1559	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-kyanometylfenyl	
1560	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-hydroxymetylenfenyl	
1561	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-karboxylfenyl	
1562	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-merkaptofenyl	
1563	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-methoxyfenyl	
1564	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3,4-metylendioxofenyl	
1565	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-tetrazolfenyl	
1566	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminosulfonylfenyl	
1567	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1568	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1569	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1570	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-metylsulfonylfenyl	
1571	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-methoxyfenyl	
1572	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-fenylfenyl	
1573	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1574	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1575	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1576	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1577	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	
1578	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1579	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1580	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1581	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1582	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1583	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1584	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1585	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1586	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1587	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1588	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1589	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1590	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1591	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1592	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1593	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1594	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1595	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1596	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1597	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1598	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	

1599	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1600	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1601	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-pyridyl	
1602	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-pyridyl	
1603	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-pyridyl	
1604	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-amino-4-pyridyl	
1605	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-hydroxy-4-pyridyl	
1606	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-imidazol	
1607	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-nitro-3-imidazol	
1608	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	5-thiazol	
1609	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	5-oxazol	
1610	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	4-pyrazol	
1611	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	fenylethyl	
1612	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-aminofenylethyl	
1613	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1614	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1615	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1616	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-aminomethylen-fenylethyl	
1617	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-tetrazolfenylethyl	
1618	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1619	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1620	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	2-methoxyfenylethyl	
1621	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminofenylethyl	
1622	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1623	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1624	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1625	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminomethylen-fenylethyl	
1626	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-tetrazolfenylethyl	
1627	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1628	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1629	NH(CO)N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-methoxyfenylethyl	
1630	terc.BuCONH	H	
1631	terc.BuCONH	metyl	
1632	terc.BuCONH	etyl	
1633	terc.BuCONH	n-propyl	
1634	terc.BuCONH	n-butyl	
1635	terc.BuCONH	n-pentyl	
1636	terc.BuCONH	n-hexanyl	
1637	terc.BuCONH	n-heptanyl	
1638	terc.BuCONH	isopropyl	
1639	terc.BuCONH	terc.butyl	
1640	terc.BuCONH	cyklopropyl	
1641	terc.BuCONH	cyklobutanyl	
1642	terc.BuCONH	cyklopentanyl	
1643	terc.BuCONH	cyklohexanyl	
1644	terc.BuCONH	cykloheptanyl	
1645	terc.BuCONH	fenyl	
1646	terc.BuCONH	fenylmetyl	
1647	terc.BuCONH	3-hydroxyfenyl	
1648	terc.BuCONH	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1649	terc.BuCONH	3-fluorfenyl	
1650	terc.BuCONH	3-chlorfenyl	
1651	terc.BuCONH	3-nitrofenyl	
1652	terc.BuCONH	3-aminofenyl	
1653	terc.BuCONH	3-metylsufonamidfenyl	
1654	terc.BuCONH	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1655	terc.BuCONH	3-Ac-NHfenyl	
1656	terc.BuCONH	3-Boc-NHfenyl	

1657	terc.BuCONH	3-Cbz-NHfenyl	
1658	terc.BuCONH	3-aminometylenfenyl	
1659	terc.BuCONH	3-aminoetylenfenyl	
1660	terc.BuCONH	3-kyanofenyl	
1661	terc.BuCONH	3-kyanometylfenyl	
1662	terc.BuCONH	3-hydroxymetylenfenyl	
1663	terc.BuCONH	3-karboxylfenyl	
1664	terc.BuCONH	3-merkaptofenyl	
1665	terc.BuCONH	3-methoxyfenyl	
1666	terc.BuCONH	3,4-metylendioxofenyl	
1667	terc.BuCONH	3-tetrazolfenyl	
1668	terc.BuCONH	3-aminosulfonylfenyl	
1669	terc.BuCONH	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1670	terc.BuCONH	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1671	terc.BuCONH	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1672	terc.BuCONH	3-metylsulfonylfenyl	
1673	terc.BuCONH	4-methoxyfenyl	
1674	terc.BuCONH	4-fenylfenyl	
1675	terc.BuCONH	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1676	terc.BuCONH	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1677	terc.BuCONH	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1678	terc.BuCONH	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1679	terc.BuCONH	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1680	terc.BuCONH	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1681	terc.BuCONH	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1682	terc.BuCONH	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1683	terc.BuCONH	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1684	terc.BuCONH	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1685	terc.BuCONH	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1686	terc.BuCONH	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1687	terc.BuCONH	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1688	terc.BuCONH	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1689	terc.BuCONH	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1690	terc.BuCONH	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1691	terc.BuCONH	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1692	terc.BuCONH	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1693	terc.BuCONH	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1694	terc.BuCONH	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1695	terc.BuCONH	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1696	terc.BuCONH	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1697	terc.BuCONH	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1698	terc.BuCONH	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1699	terc.BuCONH	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1700	terc.BuCONH	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1701	terc.BuCONH	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1702	terc.BuCONH	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1703	terc.BuCONH	2-pyridyl	
1704	terc.BuCONH	3-pyridyl	
1705	terc.BuCONH	4-pyridyl	
1706	terc.BuCONH	3-amino-4-pyridyl	
1707	terc.BuCONH	3-hydroxy-4-pyridyl	
1708	terc.BuCONH	3-imidazol	
1709	terc.BuCONH	2-nitro-3-imidazol	
1710	terc.BuCONH	5-thiazol	
1711	terc.BuCONH	5-oxazol	
1712	terc.BuCONH	4-pyrazol	

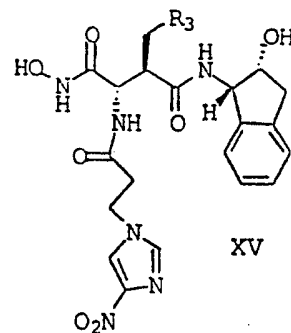
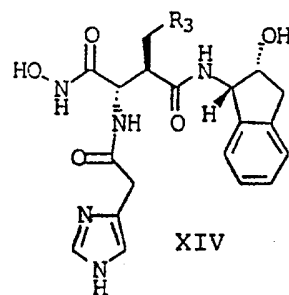
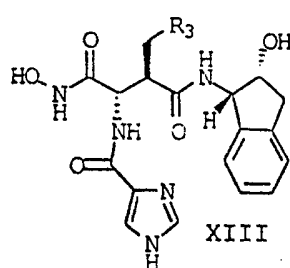
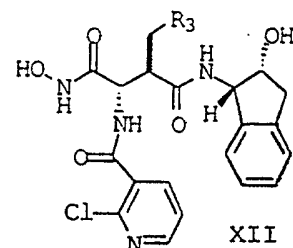
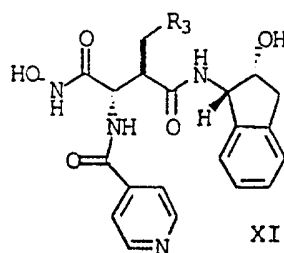
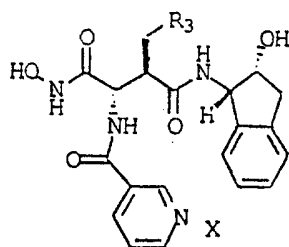
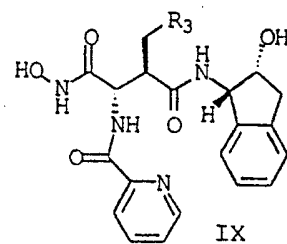
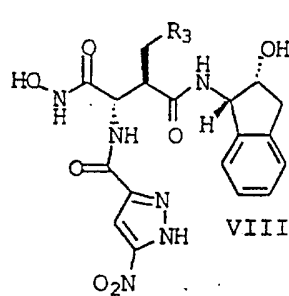
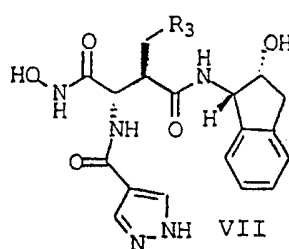
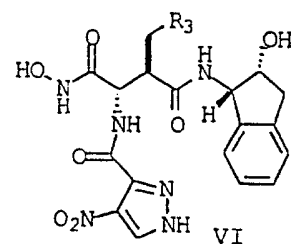
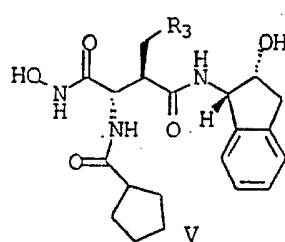
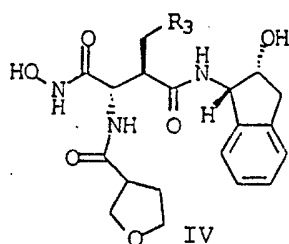
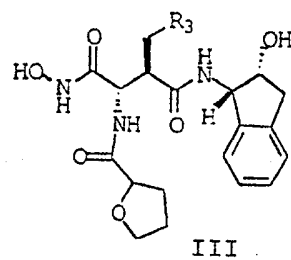
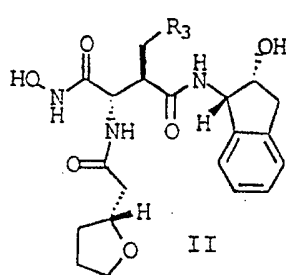
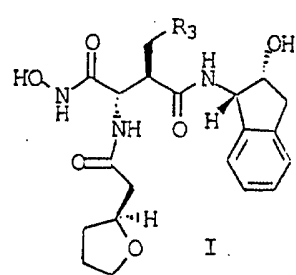
1713	terc.BuCONH	fenylethyl	
1714	terc.BuCONH	2-aminofenylethyl	
1715	terc.BuCONH	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1716	terc.BuCONH	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1717	terc.BuCONH	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1718	terc.BuCONH	2-aminomethylen-fenylethyl	
1719	terc.BuCONH	2-tetrazolfenylethyl	
1720	terc.BuCONH	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1721	terc.BuCONH	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1722	terc.BuCONH	2-methoxyfenylethyl	
1723	terc.BuCONH	3-aminofenylethyl	
1724	terc.BuCONH	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1725	terc.BuCONH	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1726	terc.BuCONH	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1727	terc.BuCONH	3-aminomethylen-fenylethyl	
1728	terc.BuCONH	3-tetrazolfenylethyl	
1729	terc.BuCONH	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1730	terc.BuCONH	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1731	terc.BuCONH	3-methoxyfenylethyl	
1732	c-C ₃ H ₅ CONH	H	
1733	c-C ₃ H ₅ CONH	metyl	
1734	c-C ₃ H ₅ CONH	etyl	
1735	c-C ₃ H ₅ CONH	n-propyl	
1736	c-C ₃ H ₅ CONH	n-butyl	
1737	c-C ₃ H ₅ CONH	n-pentyl	
1738	c-C ₃ H ₅ CONH	n-hexanyl	
1739	c-C ₃ H ₅ CONH	n-heptanyl	
1740	c-C ₃ H ₅ CONH	isopropyl	
1741	c-C ₃ H ₅ CONH	terc.butyl	
1742	c-C ₃ H ₅ CONH	cyklopropyl	
1743	c-C ₃ H ₅ CONH	cyklobutanyl	
1744	c-C ₃ H ₅ CONH	cyklopentanyl	
1745	c-C ₃ H ₅ CONH	cyklohexanyl	
1746	c-C ₃ H ₅ CONH	cykloheptanyl	
1747	c-C ₃ H ₅ CONH	fenyl	
1748	c-C ₃ H ₅ CONH	fenylmetyl	
1749	c-C ₃ H ₅ CONH	3-hydroxyfenyl	
1750	c-C ₃ H ₅ CONH	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1751	c-C ₃ H ₅ CONH	3-fluorfenyl	
1752	c-C ₃ H ₅ CONH	3-chlorfenyl	
1753	c-C ₃ H ₅ CONH	3-nitrofenyl	
1754	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminofenyl	
1755	c-C ₃ H ₅ CONH	3-metylsufonamidfenyl	
1756	c-C ₃ H ₅ CONH	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1757	c-C ₃ H ₅ CONH	3-Ac-NHfenyl	
1758	c-C ₃ H ₅ CONH	3-Boc-NHfenyl	
1759	c-C ₃ H ₅ CONH	3-Cbz-NHfenyl	
1760	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminometylenfenyl	
1761	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminoetylenfenyl	
1762	c-C ₃ H ₅ CONH	3-kyanofenyl	
1763	c-C ₃ H ₅ CONH	3-kyanometylfenyl	
1764	c-C ₃ H ₅ CONH	3-hydroxymetylenfenyl	
1765	c-C ₃ H ₅ CONH	3-karboxyfenyl	
1766	c-C ₃ H ₅ CONH	3-merkaptofenyl	
1767	c-C ₃ H ₅ CONH	3-methoxyfenyl	
1768	c-C ₃ H ₅ CONH	3,4-metylendioxofenyl	
1769	c-C ₃ H ₅ CONH	3-tetrazolfenyl	
1770	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminosulfonylfenyl	

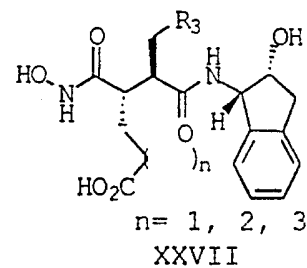
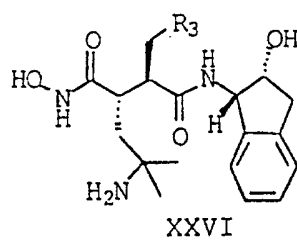
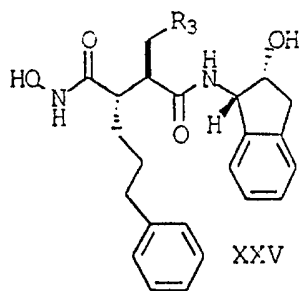
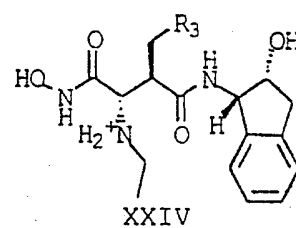
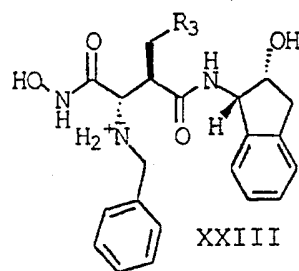
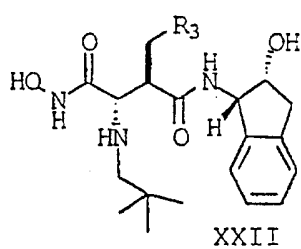
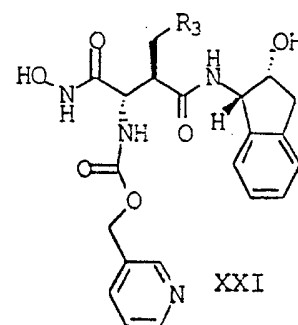
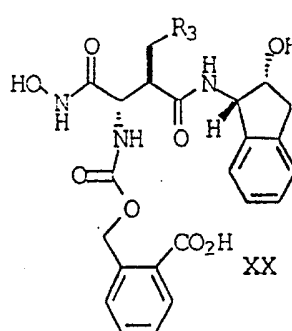
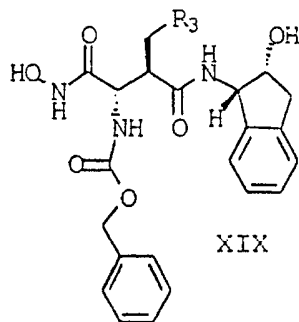
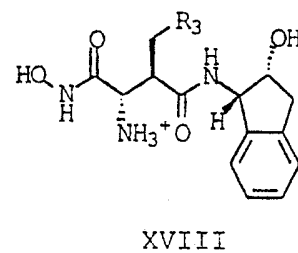
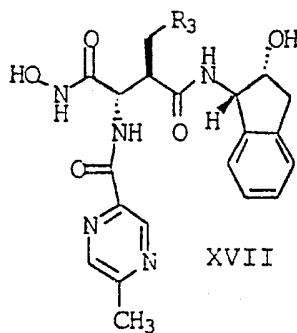
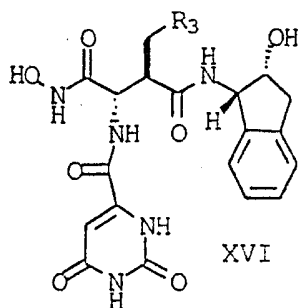
1771	c-C ₃ H ₅ CONH	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1772	c-C ₃ H ₅ CONH	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1773	c-C ₃ H ₅ CONH	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1774	c-C ₃ H ₅ CONH	3-metylsulfonylfenyl	
1775	c-C ₃ H ₅ CONH	4-methoxyfenyl	
1776	c-C ₃ H ₅ CONH	4-fenylfenyl	
1777	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1778	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1779	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1780	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1781	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1782	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1783	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1784	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1785	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1786	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1787	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1788	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1789	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1790	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1791	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1792	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1793	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1794	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1795	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
1796	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
1797	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1798	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1799	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1800	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1801	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1802	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1803	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1804	c-C ₃ H ₅ CONH	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1805	c-C ₃ H ₅ CONH	2-pyridyl	
1806	c-C ₃ H ₅ CONH	3-pyridyl	
1807	c-C ₃ H ₅ CONH	4-pyridyl	
1808	c-C ₃ H ₅ CONH	3-amino-4-pyridyl	
1809	c-C ₃ H ₅ CONH	3-hydroxy-4-pyridyl	
1810	c-C ₃ H ₅ CONH	3-imidazol	
1811	c-C ₃ H ₅ CONH	2-nitro-3-imidazol	
1812	c-C ₃ H ₅ CONH	5-thiazol	
1813	c-C ₃ H ₅ CONH	5-oxazol	
1814	c-C ₃ H ₅ CONH	4-pyrazol	
1815	c-C ₃ H ₅ CONH	fenylethyl	
1816	c-C ₃ H ₅ CONH	2-aminofenylethyl	
1817	c-C ₃ H ₅ CONH	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1818	c-C ₃ H ₅ CONH	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1819	c-C ₃ H ₅ CONH	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1820	c-C ₃ H ₅ CONH	2-aminomethylen-fenylethyl	
1821	c-C ₃ H ₅ CONH	2-tetrazolfenylethyl	
1822	c-C ₃ H ₅ CONH	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1823	c-C ₃ H ₅ CONH	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1824	c-C ₃ H ₅ CONH	2-methoxyfenylethyl	
1825	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminofenylethyl	
1826	c-C ₃ H ₅ CONH	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	

1827	c-C ₃ H ₅ CONH	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1828	c-C ₃ H ₅ CONH	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1829	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminomethylen-fenylethyl	
1830	c-C ₃ H ₅ CONH	3-tetrazolfenylethyl	
1831	c-C ₃ H ₅ CONH	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1832	c-C ₃ H ₅ CONH	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1833	c-C ₃ H ₅ CONH	3-methoxyfenylethyl	
1834			
1835		H	
1836	"	metyl	
1837	"	etyl	
1838	"	n-propyl	
1839	"	n-butyl	
1840	"	n-pentyl	
1841	"	n-hexanyl	
1842	"	n-heptanyl	
1843	"	isopropyl	
1844	"	terc.butyl	
1845	"	cyklopropyl	
1846	"	cyklobutanyl	
1847	"	cyklopentanyl	
1848	"	cyklohexanyl	
1849	"	cykloheptanyl	
1850	"	fenyl	
1851	"	fenylmetyl	
1852	"	3-hydroxyfenyl	
1853	"	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
1854	"	3-fluorfenyl	
1855	"	3-chlorfenyl	
1856	"	3-nitrofenyl	
1857	"	3-aminofenyl	
1858	"	3-metylsufonamidfenyl	
1859	"	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
1860	"	3-Ac-NHfenyl	
1861	"	3-Boc-NHfenyl	
1862	"	3-Cbz-NHfenyl	
1863	"	3-aminometylenfenyl	
1864	"	3-aminoetylenfenyl	
1865	"	3-kyanofenyl	
1866	"	3-kyanometylfenyl	
1867	"	3-hydroxymetylenfenyl	
1868	"	3-karboxylfenyl	
1869	"	3-merkaptofenyl	
1870	"	3-methoxyfenyl	
1871	"	3,4-metylendioxofenyl	
1872	"	3-tetrazolfenyl	
1873	"	3-aminosulfonylfenyl	
1874	"	3-metylamino-sulfonylfenyl	
1875	"	3-etylamino-sulfonylfenyl	
1876	"	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
1877	"	3-metylsulfonylfenyl	
1878	"	4-methoxyfenyl	
1879	"	4-fenylfenyl	
1880	"	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
1881	"	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
1882	"	4-(2-metylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1883	"	4-(2-ethylamino-sufonylfenyl)-fenyl	
1884	"	4-(2-amino-sufonylfenyl)-fenyl	

1885	"	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
1886	"	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
1887	"	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
1888	"	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
1889	"	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
1890	"	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
1891	"	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
1892	"	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
1893	"	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
1894	"	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
1895	"	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
1896	"	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
1897	"	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
1898	"	4-(2-etyl-amino-fenyl)-fenyl	
1899	"	4-(2-propyl-amino-fenyl)-fenyl	
1900	"	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1901	"	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1902	"	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
1903	"	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
1904	"	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
1905	"	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
1906	"	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
1907	"	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
1908	"	2-pyridyl	
1909	"	3-pyridyl	
1910	"	4-pyridyl	
1911	"	3-amino-4-pyridyl	
1912	"	3-hydroxy-4-pyridyl	
1913	"	3-imidazol	
1914	"	2-nitro-3-imidazol	
1915	"	5-thiazol	
1916	"	5-oxazol	
1917	"	4-pyrazol	
1918	"	fenylethyl	
1919	"	2-aminofenylethyl	
1920	"	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1921	"	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1922	"	2-hydroxymethylen-fenylethyl	
1923	"	2-aminomethylen-fenylethyl	
1924	"	2-tetrazolfenylethyl	
1925	"	2-terc.-butylamino-sulfonylfenylethyl	
1926	"	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
1927	"	2-methoxyfenylethyl	
1928	"	3-aminofenylethyl	
1929	"	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
1930	"	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
1931	"	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
1932	"	3-aminomethylen-fenylethyl	
1933	"	3-tetrazolfenylethyl	
1934	"	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
1935	"	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
1936	"	3-methoxyfenylethyl	

Tabulka 3

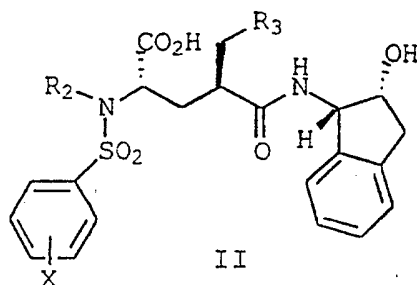
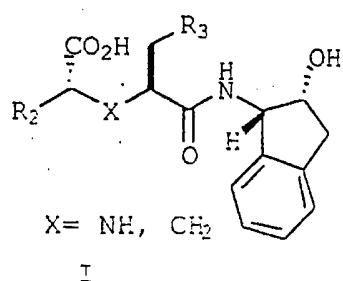




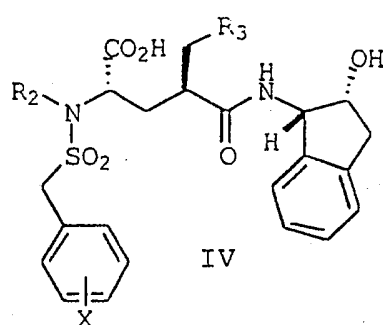
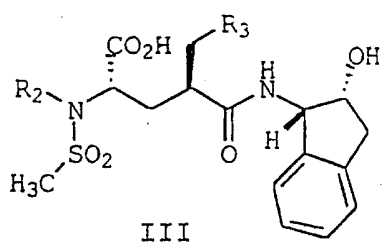
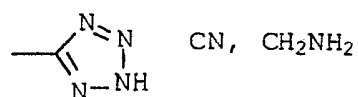
Př. č.	R3	Ms	Př. č.	R3	Ms
2000	H		2001	4-(2-aminosulfonylphenyl)-phenyl	
2002	methyl		2003	4-(2-chlorophenyl)-phenyl	
2004	ethyl		2005	4-(2-fluorophenyl)-phenyl	
2006	n-propyl		2007	4-(2,4-dichlorophenyl)-phenyl	
2008	n-butyl		2009	4-(2,6-dichlorophenyl)-phenyl	
2010	n-pentyl		2011	4-(3,5-dichlorophenyl)-phenyl	
2012	n-hexanyl		2013	4-(2,3-dichlorophenyl)-phenyl	
2014	n-heptyl		2015	4-(2-methylphenyl)-phenyl	
2016	isopropyl		2017	4-(2-tetrazolphenyl)-phenyl	
2018	terc.butyl		2019	4-(2-methoxy-phenyl)-phenyl	
2020	cyklopropyl		2021	4-(2-tmethyl-phenyl)-phenyl	
2022	cyklobutanyl		2023	4-(2-formyl-phenyl)-phenyl	
2024	cyklopentanyl		2025	4-(2-amino-phenyl)-phenyl	
2026	cyklohexanyl		2027	4-(2-methylamino-phenyl)-phenyl	
2028	cykloheptanyl		2029	4-(2-ethylamino-phenyl)-phenyl	
2030	phenyl		2031	4-(2-propylamino-phenyl)-phenyl	
2032	phenylmethyl		2033	4-(2-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2034	3-hydroxyphenyl		2035	4-(2-trifluormethylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2036	3-hydroxy-4-methoxyphenyl		2037	4-(3-methylphenyl)-phenyl	
2038	3-fluorophenyl		2039	4-(3-isopropylphenyl)-phenyl	
2040	3-chlorophenyl		2041	4-(3-trifluormethylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2042	3-nitrophenyl		2043	4-(3-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2044	3-aminophenyl		2045	4-(3-amino-phenyl)-phenyl	
2046	3-methylsulfonylamidphenyl		2047	4-(3-nitro-phenyl)-phenyl	
2048	3-trifluor-methyl-sulfonylamidphenyl		2049	2-pyridyl	
2050	3-Ac-NHphenyl		2051	3-pyridyl	
2052	3-Boc-NHphenyl		2053	4-pyridyl	
2054	3-Cbz-NHphenyl		2055	3-amino-4-pyridyl	
2056	3-aminomethylen-phenyl		2057	3-hydroxy-4-pyridyl	
2058	3-amino-ethylenphenyl		2059	3-imidazol	
2060	3-kyanophenyl		2061	2-nitro-3-imidazol	
2062	3-kyanomethylphenyl		2063	5-thiazol	
2064	3-hydroxymethylenphenyl		2065	5-oxazol	
2066	3-karboxylphenyl		2067	4-pyrazol	
2068	3-merkaptophenyl		2069	phenylethyl	
2070	3-merkaptophenyl		2071	2-aminophenylethyl	
2072	3,4-methylenedioxyphenyl		2073	2-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2074	3-tetrazolphenyl		2075	2-trifluormethylsulfonylamino-phenylethyl	
2076	3-aminosulfonylphenyl		2077	2-hydroxymethylen-phenylethyl	
2078	3-methylamino-sulfonylphenyl		2079	2-aminomethylen-phenylethyl	
2080	3-ethylamino-sulfonylphenyl		2081	2-tetrazol-phenylethyl	
2082	3-terc.butylamino-sulfonylphenyl		2083	2-terc.butylamino-sulfonylphenylethyl	
2084	3-methylsulfonyl-phenyl		2085	2-aminosulfonyl-phenylethyl	
2086	4-methoxyphenyl		2087	2-methoxy-phenylethyl	
2088	4-phenylphenyl		2089	3-aminophenylethyl	
2090	4-(2-hydroxymethylen-phenyl)-phenyl		2091	3-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2092	4-(2-terc.butylaminosulfonyl)-		2093	3-trifluormethylsulfonylamino-	

	fenyl			fenylethyl	
2094	4-(2-methylaminosulfonylphenyl)-phenyl		2095	3-hydroxymethylen-phenylethyl	
2096	4-(2-ethylaminosulfonyl)-phenyl		2097	3-aminoethylen-phenylethyl	
2098			2099	3-tetrazol-phenylethyl	
2100			2101	3-terc.butylaminosulfonyl-phenylethyl	
2102			2103	3-aminosulfonyl-phenylethyl	
2104			2105	3-methoxy-phenylethyl	

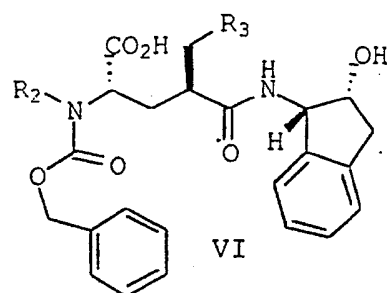
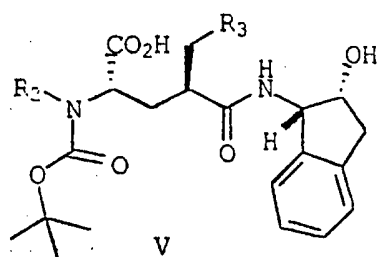
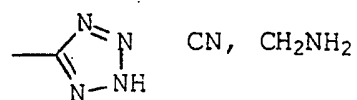
Tabulka 4



X = H, NH₂, CO₂H, CH₂CO₂H, Cl, F,



X = H, NH₂, CO₂H, CH₂CO₂H, Cl, F,



Př. č.	R ₂	R ₃	
2500	n-Bu	H	
2501	n-Bu	metyl	
2502	n-Bu	etyl	
2503	n-Bu	n-propyl	
2504	n-Bu	n-butyl	
2505	n-Bu	n-pentyl	

2506	n-Bu	n-hexanyl	
2507	n-Bu	n-heptanyl	
2508	n-Bu	isopropyl	
2509	n-Bu	terc.butyl	
2510	n-Bu	cyklopropyl	
2511	n-Bu	cyklobutanyl	
2512	n-Bu	cyklopentanyl	
2513	n-Bu	cyklohexanyl	
2514	n-Bu	cykloheptanyl	
2515	n-Bu	fenyl	
2516	n-Bu	fenylmetyl	
2517	n-Bu	3-hydroxyfenyl	
2518	n-Bu	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
2519	n-Bu	3-fluorfenyl	
2520	n-Bu	3-chlorfenyl	
2521	n-Bu	3-nitrofenyl	
2522	n-Bu	3-aminofenyl	
2523	n-Bu	3-metyl-sufonamidfenyl	
2524	n-Bu	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
2525	n-Bu	3-Ac-NHfenyl	
2526	n-Bu	3-Boc-NHfenyl	
2527	n-Bu	3-Cbz-NHfenyl	
2528	n-Bu	3-aminometylenfenyl	
2529	n-Bu	3-aminoetylenfenyl	
2530	n-Bu	3-kyanofenyl	
2531	n-Bu	3-kyanometylfenyl	
2532	n-Bu	3-hydroxymetylenfenyl	
2533	n-Bu	3-karboxylfenyl	
2534	n-Bu	3-merkaptofenyl	
2535	n-Bu	3-methoxyfenyl	
2536	n-Bu	3,4-metylendioxofenyl	
2537	n-Bu	3-tetrazolfenyl	
2538	n-Bu	3-aminosulfonylfenyl	
2539	n-Bu	3-metylamino-sulfonylfenyl	
2540	n-Bu	3-etylamino-sulfonylfenyl	
2541	n-Bu	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
2542	n-Bu	3-metylsulfonylfenyl	
2543	n-Bu	4-methoxyfenyl	
2544	n-Bu	4-fenylfenyl	
2545	n-Bu	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
2546	n-Bu	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2547	n-Bu	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2548	n-Bu	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2549	n-Bu	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2550	n-Bu	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
2551	n-Bu	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
2552	n-Bu	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
2553	n-Bu	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
2554	n-Bu	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
2555	n-Bu	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
2556	n-Bu	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
2557	n-Bu	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
2558	n-Bu	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
2559	n-Bu	4-(2-metyl-fenyl)-fenyl	
2560	n-Bu	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
2561	n-Bu	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
2562	n-Bu	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
2563	n-Bu	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	

2564	n-Bu	4-(2-propylamino-phenyl)-phenyl	
2565	n-Bu	4-(2-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2566	n-Bu	4-(2-trifluoromethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
2567	n-Bu	4-(3-methylphenyl)-phenyl	
2568	n-Bu	4-(3-isopropylphenyl)-phenyl	
2569	n-Bu	4-(3-trifluoromethyl-sulfonyl-amino-phenyl)-phenyl	
2570	n-Bu	4-(3-methylsulfonylamino-phenyl)-phenyl	
2571	n-Bu	4-(3-amino-phenyl)-phenyl	
2572	n-Bu	4-(3-nitro-phenyl)-phenyl	
2573	n-Bu	2-pyridyl	
2574	n-Bu	3-pyridyl	
2575	n-Bu	4-pyridyl	
2576	n-Bu	3-amino-4-pyridyl	
2577	n-Bu	3-hydroxy-4-pyridyl	
2578	n-Bu	3-imidazol	
2579	n-Bu	2-nitro-3-imidazol	
2580	n-Bu	5-thiazol	
2581	n-Bu	5-oxazol	
2582	n-Bu	4-pyrazol	
2583	n-Bu	phenylethyl	
2584	n-Bu	2-aminophenylethyl	
2585	n-Bu	2-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2586	n-Bu	2-trifluoromethylsulfonylamino-phenylethyl	
2587	n-Bu	2-hydroxymethylen-phenylethyl	
2588	n-Bu	2-aminomethylen-phenylethyl	
2589	n-Bu	2-tetrazolphenylethyl	
2590	n-Bu	2-tert.-butylamino-sulfonylphenylethyl	
2591	n-Bu	2-aminosulfonyl-phenylethyl	
2592	n-Bu	2-methoxyphenylethyl	
2593	n-Bu	3-aminophenylethyl	
2594	n-Bu	3-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2595	n-Bu	3-trifluoromethylsulfonylamino-phenylethyl	
2596	n-Bu	3-hydroxymethylen-phenylethyl	
2597	n-Bu	3-aminomethylen-phenylethyl	
2598	n-Bu	3-tetrazolphenylethyl	
2599	n-Bu	3-tert.butylamino-sulfonylphenylethyl	
2600	n-Bu	3-aminosulfonyl-phenylethyl	
2601	n-Bu	3-methoxyphenylethyl	
2602	n-Bu	4-phenylphenylmethyl	
2603	n-Bu	4-(2-hydroxymethylen)-phenylmethyl	
2604	n-Bu	4-(2-tert.butylaminosulfonyl-phenyl)-phenylmethyl	
2605	n-Bu	4-(2-methylaminosulfonylphenyl)-phenylmethyl	
2606	n-Bu	4-(2-ethylaminosulfonyl)-phenylmethyl	
2607	n-Bu	4-(2-aminosulfonylphenyl)-phenylmethyl	
2608	n-Bu	4-(2-chlorophenyl)-phenylmethyl	
2609	n-Bu	4-(2-fluorophenyl)-phenylmethyl	
2610	n-Bu	4-(2,4-dichlorophenyl)-phenylmethyl	
2611	n-Bu	4-(2,6-dichlorophenyl)-phenylmethyl	
2612	n-Bu	4-(3,5-dichlorophenyl)phenylmethyl	
2613	n-Bu	4-(2,3-dichlorophenyl)phenylmethyl	
2614	n-Bu	4-(2-methylphenyl)-phenylmethyl	
2615	n-Bu	4-(2-tetrazol-phenyl)-phenylmethyl	
2616	n-Bu	4-(2-methoxy-phenyl)-phenylmethyl	
2617	n-Bu	4-(2-methyl-phenyl)-phenylmethyl	

2618	n-Bu	4-(2-formyl-fenyl)-fenylmethyl	
2619	n-Bu	4-(2-amino-fenyl)-efnylmethyl	
2620	n-Bu	4-(2-methylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2621	n-Bu	4-(2-ethylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2622	n-Bu	4-(2-propylamino-fenyl)-fnylmethyl	
2623	n-Bu	4-(2-methylsulfonylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2624	n-Bu	4-(2-trifluormethylsulfonyl-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2625	n-Bu	4-(3-methylfenyl)-fenylmethyl	
2626	n-Bu	4-(3-isopropylfenyl)-fenylmethyl	
2627	n-Bu	4-(3-trifluormethylsulfonyl-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2628	n-Bu	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2629	n-Bu	4-(3-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2630	n-Bu	4-(3-nitro-fenyl)-fenylmethyl	
2631			
2632	CH ₃	H	
2633	CH ₃	metyl	
2634	CH ₃	etyl	
2635	CH ₃	n-propyl	
2636	CH ₃	n-butyl	
2637	CH ₃	n-pentyl	
2638	CH ₃	n-hexanyl	
2639	CH ₃	n-heptanyl	
2640	CH ₃	isopropyl	
2641	CH ₃	terc.butyl	
2642	CH ₃	cyklopropyl	
2643	CH ₃	cyklobutanyl	
2644	CH ₃	cyklopentanyl	
2645	CH ₃	cyklohexanyl	
2646	CH ₃	cykloheptanyl	
2647	CH ₃	fenyl	
2648	CH ₃	fenylmetyl	
2649	CH ₃	3-hydroxyfenyl	
2650	CH ₃	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
2651	CH ₃	3-fluorfenyl	
2652	CH ₃	3-chlorfenyl	
2653	CH ₃	3-nitrofenyl	
2654	CH ₃	3-aminofenyl	
2655	CH ₃	3-metyl-sufonamidfenyl	
2656	CH ₃	3-trifluor-metyl-sulfonamidfenyl	
2657	CH ₃	3-Ac-NHfenyl	
2658	CH ₃	3-Boc-NHfenyl	
2659	CH ₃	3-Cbz-NHfenyl	
2660	CH ₃	3-aminometylenfenyl	
2661	CH ₃	3-aminoetylenfenyl	
2662	CH ₃	3-kyanofenyl	
2663	CH ₃	3-kyanometylfenyl	
2664	CH ₃	3-hydroxymetylenfenyl	
2665	CH ₃	3-karboxylfenyl	
2666	CH ₃	3-merkaptofenyl	
2667	CH ₃	3-methoxyfenyl	
2668	CH ₃	3,4-metylendioxofenyl	
2669	CH ₃	3-tetrazolfenyl	
2670	CH ₃	3-aminosulfonylfenyl	
2671	CH ₃	3-metylamino-sulfonylfenyl	

2672	CH ₃	3-ethylamino-sulfonylphenyl	
2673	CH ₃	3-terc. butylamino-sulfonylphenyl	
2674	CH ₃	3-methylsulfonylphenyl	
2675	CH ₃	4-methoxyphenyl	
2676	CH ₃	4-phenylphenyl	
2677	CH ₃	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
2678	CH ₃	4-(2-terc. butylamino-sulfonylphenyl)-fenyl	
2679	CH ₃	4-(2-methylamino-sulfonylphenyl)-fenyl	
2680	CH ₃	4-(2-ethylamino-sulfonylphenyl)-fenyl	
2681	CH ₃	4-(2-amino-sulfonylphenyl)-fenyl	
2682	CH ₃	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
2683	CH ₃	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
2684	CH ₃	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
2685	CH ₃	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
2686	CH ₃	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
2687	CH ₃	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
2688	CH ₃	4-(2-methylfenyl)-fenyl	
2689	CH ₃	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
2690	CH ₃	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
2691	CH ₃	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
2692	CH ₃	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
2693	CH ₃	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
2694	CH ₃	4-(2-methylamino-fenyl)-fenyl	
2695	CH ₃	4-(2-ethylamino-fenyl)-fenyl	
2696	CH ₃	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
2697	CH ₃	4-(2-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
2698	CH ₃	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
2699	CH ₃	4-(3-methylfenyl)-fenyl	
2700	CH ₃	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
2701	CH ₃	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
2702	CH ₃	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
2703	CH ₃	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	
2704	CH ₃	4-(3-nitro-fenyl)-fenyl	
2705	CH ₃	2-pyridyl	
2706	CH ₃	3-pyridyl	
2707	CH ₃	4-pyridyl	
2708	CH ₃	3-amino-4-pyridyl	
2709	CH ₃	3-hydroxy-4-pyridyl	
2710	CH ₃	3-imidazol	
2711	CH ₃	2-nitro-3-imidazol	
2712	CH ₃	5-thiazol	
2713	CH ₃	5-oxazol	
2714	CH ₃	4-pyrazol	
2715	CH ₃	fenylethyl	
2716	CH ₃	2-aminofenylethyl	
2717	CH ₃	2-methylsulfonylamino-fenylethyl	
2718	CH ₃	2-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	
2719	CH ₃	2-hydroxymetylen-fenylethyl	
2720	CH ₃	2-aminometylen-fenylethyl	
2721	CH ₃	2-tetrazolfenylethyl	
2722	CH ₃	2-terc.-butylamino-sulfonylphenylethyl	
2723	CH ₃	2-aminosulfonyl-fenylethyl	
2724	CH ₃	2-methoxyfenylethyl	
2725	CH ₃	3-aminofenylethyl	
2726	CH ₃	3-methylsulfonylamino-fenylethyl	
2727	CH ₃	3-trifluormethylsulfonylamino-fenylethyl	

2728	CH ₃	3-hydroxymethylen-fenylethyl	
2729	CH ₃	3-aminomethylen-fenylethyl	
2730	CH ₃	3-tetrazolfenylethyl	
2731	CH ₃	3-terc.butylamino-sulfonylfenylethyl	
2732	CH ₃	3-aminosulfonyl-fenylethyl	
2733	CH ₃	3-methoxyfenylethyl	
2734	CH ₃	4-fenylfenylmethyl	
2735	CH ₃	4-(2-hydroxymethylen)-fenylmethyl	
2736	CH ₃	4-(2-terc.butylaminosulfonyl-fenyl)-fenylmethyl	
2737	CH ₃	4-(2-methylaminosulfonylfenyl)-fenylmethyl	
2738	CH ₃	4-(2-ethylaminosulfonyl)-fenylmethyl	
2739	CH ₃	4-(2-aminosulfonylfenyl)-fenylmethyl	
2740	CH ₃	4-(2-chlorfenyl)-fenylmethyl	
2741	CH ₃	4-(2-fluorfenyl)-fenylmethyl	
2742	CH ₃	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenylmethyl	
2743	CH ₃	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenylmethyl	
2744	CH ₃	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenylmethyl	
2745	CH ₃	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenylmethyl	
2746	CH ₃	4-(2-methylfenyl)-fenylmethyl	
2747	CH ₃	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenylmethyl	
2748	CH ₃	4-(2-methoxy-fenyl)-fenylmethyl	
2749	CH ₃	4-(2-tmethyl-fenyl)-fenylmethyl	
2750	CH ₃	4-(2-formyl-fenyl)-fenylmethyl	
2751	CH ₃	4-(2-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2752	CH ₃	4-(2-methylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2753	CH ₃	4-(2-ethylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2754	CH ₃	4-(2-propylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2755	CH ₃	4-(2-methylsulfonylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2756	CH ₃	4-(2-trifluormethylsulfonyl-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2757	CH ₃	4-(3-methylfenyl)-fenylmethyl	
2758	CH ₃	4-(3-isopropylfenyl)-fenylmethyl	
2759	CH ₃	4-(3-trifluormethylsulfonyl-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2760	CH ₃	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenylmethyl	
2761	CH ₃	4-(3-amino-fenyl)-fenylmethyl	
2762	CH ₃	4-(3-nitro-fenyl)-fenylmethyl	
2763			
2764	3-fenylpropyl	H	
2765	3-fenylpropyl	metyl	
2766	3-fenylpropyl	etyl	
2767	3-fenylpropyl	n-propyl	
2768	3-fenylpropyl	n-butyl	
2769	3-fenylpropyl	n-pentyl	
2770	3-fenylpropyl	n-hexanyl	
2771	3-fenylpropyl	n-heptanyl	
2772	3-fenylpropyl	isopropyl	
2773	3-fenylpropyl	terc.butyl	
2774	3-fenylpropyl	cyklopropyl	
2775	3-fenylpropyl	cyklobutanyl	
2776	3-fenylpropyl	cyklopentanyl	
2777	3-fenylpropyl	cyklohexanyl	
2778	3-fenylpropyl	cykloheptanyl	
2779	3-fenylpropyl	fenyl	

2780	3-fenylpropyl	fenylmetyl	
2781	3-fenylpropyl	3-hydroxyfenyl	
2782	3-fenylpropyl	3-hydroxy-4-methoxyfenyl	
2783	3-fenylpropyl	3-fluorfenyl	
2784	3-fenylpropyl	3-chlorfenyl	
2785	3-fenylpropyl	3-nitrofenyl	
2786	3-fenylpropyl	3-aminofenyl	
2787	3-fenylpropyl	3-metyl-sufonamidfenyl	
2788	3-fenylpropyl	3-trifluor-metylsulfonamidfenyl	
2789	3-fenylpropyl	3-Ac-NHfenyl	
2790	3-fenylpropyl	3-Boc-NHfenyl	
2791	3-fenylpropyl	3-Cbz-NHfenyl	
2792	3-fenylpropyl	3-aminometylenfenyl	
2793	3-fenylpropyl	3-aminoetylenfenyl	
2794	3-fenylpropyl	3-kyanofenyl	
2795	3-fenylpropyl	3-kyanometylfenyl	
2796	3-fenylpropyl	3-hydroxymetylenfenyl	
2797	3-fenylpropyl	3-karboxylfenyl	
2798	3-fenylpropyl	3-merkaptofenyl	
2799	3-fenylpropyl	3-methoxyfenyl	
2800	3-fenylpropyl	3,4-metylendioxofenyl	
2801	3-fenylpropyl	3-tetrazolfenyl	
2802	3-fenylpropyl	3-aminosulfonylfenyl	
2803	3-fenylpropyl	3-metylamino-sulfonylfenyl	
2804	3-fenylpropyl	3-etylamino-sulfonylfenyl	
2805	3-fenylpropyl	3-terc.butylamino-sulfonylfenyl	
2806	3-fenylpropyl	3-metylsulfonylfenyl	
2807	3-fenylpropyl	4-methoxyfenyl	
2808	3-fenylpropyl	4-fenylfenyl	
2809	3-fenylpropyl	4-(2-hydroxy-metylenfenyl)-fenyl	
2810	3-fenylpropyl	4-(2-terc.butylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2811	3-fenylpropyl	4-(2-metylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2812	3-fenylpropyl	4-(2-ethylamino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2813	3-fenylpropyl	4-(2-amino-sulfonylfenyl)-fenyl	
2814	3-fenylpropyl	4-(2-chlorfenyl)-fenyl	
2815	3-fenylpropyl	4-(2-fluorfenyl)-fenyl	
2816	3-fenylpropyl	4-(2,4-dichlorfenyl)-fenyl	
2817	3-fenylpropyl	4-(2,6-dichlorfenyl)-fenyl	
2818	3-fenylpropyl	4-(3,5-dichlorfenyl)-fenyl	
2819	3-fenylpropyl	4-(2,3-dichlorfenyl)-fenyl	
2820	3-fenylpropyl	4-(2-metylfenyl)-fenyl	
2821	3-fenylpropyl	4-(2-tetrazol-fenyl)-fenyl	
2822	3-fenylpropyl	4-(2-methoxy-fenyl)-fenyl	
2823	3-fenylpropyl	4-(2-tmetyl-fenyl)-fenyl	
2824	3-fenylpropyl	4-(2-formyl-fenyl)-fenyl	
2825	3-fenylpropyl	4-(2-amino-fenyl)-fenyl	
2826	3-fenylpropyl	4-(2-metylamino-fenyl)-fenyl	
2827	3-fenylpropyl	4-(2-etylamino-fenyl)-fenyl	
2828	3-fenylpropyl	4-(2-propylamino-fenyl)-fenyl	
2829	3-fenylpropyl	4-(2-metylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
2830	3-fenylpropyl	4-(2-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
2831	3-fenylpropyl	4-(3-metylfenyl)-fenyl	
2832	3-fenylpropyl	4-(3-isopropylfenyl)-fenyl	
2833	3-fenylpropyl	4-(3-trifluormetyl-sulfonyl-amino-fenyl)-fenyl	
2834	3-fenylpropyl	4-(3-methylsulfonylamino-fenyl)-fenyl	
2835	3-fenylpropyl	4-(3-amino-fenyl)-fenyl	

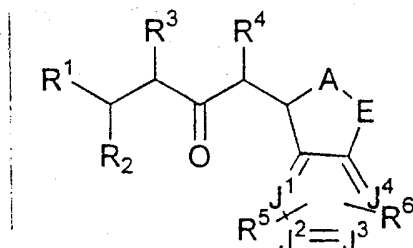
2836	3-phenylpropyl	4-(3-nitro-phenyl)-phenyl	
2837	3-phenylpropyl	2-pyridyl	
2838	3-phenylpropyl	3-pyridyl	
2839	3-phenylpropyl	4-pyridyl	
2840	3-phenylpropyl	3-amino-4-pyridyl	
2841	3-phenylpropyl	3-hydroxy-4-pyridyl	
2842	3-phenylpropyl	3-imidazol	
2843	3-phenylpropyl	2-nitro-3-imidazol	
2844	3-phenylpropyl	5-thiazol	
2845	3-phenylpropyl	5-oxazol	
2846	3-phenylpropyl	4-pyrazol	
2847	3-phenylpropyl	phenylethyl	
2848	3-phenylpropyl	2-aminophenylethyl	
2849	3-phenylpropyl	2-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2850	3-phenylpropyl	2-trifluormethylsulfonylamino-phenylethyl	
2851	3-phenylpropyl	2-hydroxymethylen-phenylethyl	
2852	3-phenylpropyl	2-aminomethylen-phenylethyl	
2853	3-phenylpropyl	2-tetrazolphenylethyl	
2854	3-phenylpropyl	2-tert.-butylamino-sulfonylphenylethyl	
2855	3-phenylpropyl	2-aminosulfonyl-phenylethyl	
2856	3-phenylpropyl	2-methoxyphenylethyl	
2857	3-phenylpropyl	3-aminophenylethyl	
2858	3-phenylpropyl	3-methylsulfonylamino-phenylethyl	
2859	3-phenylpropyl	3-trifluormethylsulfonylamino-phenylethyl	
2860	3-phenylpropyl	3-hydroxymethylen-phenylethyl	
2861	3-phenylpropyl	3-aminomethylen-phenylethyl	
2862	3-phenylpropyl	3-tetrazolphenylethyl	
2863	3-phenylpropyl	3-tert. butylamino-sulfonylphenylethyl	
2864	3-phenylpropyl	3-aminosulfonyl-phenylethyl	
2865	3-phenylpropyl	3-methoxyphenylethyl	
2666	3-phenylpropyl	4-phenylphenylmethyl	
2867	3-phenylpropyl	4-(2-hydroxymethylen)-phenylmethyl	
2868	3-phenylpropyl	4-(2-tert. butylaminosulfonyl-phenyl)-phenylmethyl	
2869	3-phenylpropyl	4-(2-methylaminosulfonylphenyl)-phenylmethyl	
2870	3-phenylpropyl	4-(2-ethylaminosulfonyl)-phenylmethyl	
2871	3-phenylpropyl	4-(2-aminosulfonylphenyl)-phenylmethyl	
2872	3-phenylpropyl	4-(2-chlorophenyl)-phenylmethyl	
2873	3-phenylpropyl	4-(2-fluorophenyl)-phenylmethyl	
2874	3-phenylpropyl	4-(2,4-dichlorophenyl)-phenylmethyl	
2875	3-phenylpropyl	4-(2,6-dichlorophenyl)-phenylmethyl	
2876	3-phenylpropyl	4-(3,5-dichlorophenyl)phenylmethyl	
2877	3-phenylpropyl	4-(2,3-dichlorophenyl)phenylmethyl	
2878	3-phenylpropyl	4-(2-methylphenyl)-phenylmethyl	
2879	3-phenylpropyl	4-(2-tetrazol-phenyl)-phenylmethyl	
2880	3-phenylpropyl	4-(2-methoxy-phenyl)-phenylmethyl	
2881	3-phenylpropyl	4-(2-tmethyl-phenyl)-phenylmethyl	
2882	3-phenylpropyl	4-(2-formyl-phenyl)-phenylmethyl	
2883	3-phenylpropyl	4-(2-amino-phenyl)-phenylmethyl	
2884	3-phenylpropyl	4-(2-methylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2885	3-phenylpropyl	4-(2-ethylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2886	3-phenylpropyl	4-(2-propylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2887	3-phenylpropyl	4-(2-methylsulfonylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2888	3-phenylpropyl	4-(2-trifluormethylsulfonyl-amino-phenyl)-phenylmethyl	
2889	3-phenylpropyl	4-(3-methylphenyl)-phenylmethyl	

16.02.00

2890	3-phenylpropyl	4-(3-isopropylphenyl)-phenylmethyl	
2891	3-phenylpropyl	4-(3-trifluoromethylsulfonylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2892	3-phenylpropyl	4-(3-methylsulfonylamino-phenyl)-phenylmethyl	
2893	3-phenylpropyl	4-(3-amino-phenyl)-phenylmethyl	
2894	3-phenylpropyl	4-(3-nitro-phenyl)-phenylmethyl	

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Sloučenina obecného vzorce I



Obecný vzorec I

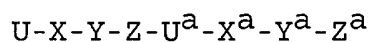
nebo její farmaceuticky přijatelná sůl nebo její stereoisomer,
kde

R^1 se zvolí z:

-CO₂H, -C(O)NHOH, -C(O)NHR⁷, -SH, -CH₂CO₂R⁷, -COR⁷,
-N(OH)COR⁷, -SN₂H₂R⁷, -SONHR⁷, -CH₂CO₂H, -PO(OH)₂,
-PO(OH)NHR⁷, -CH₂SH, -C(O)NHR⁷, -CO₂R⁷

a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

kde:

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku

substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karboxylového zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

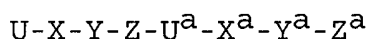
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,

Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, NR^aS(O)₂R^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R³ se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenů, C₂₋₁₀ alkenylenů,
C₂₋₁₀ alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a,
NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a,
S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenů, C₂₋₁₀ alkenylenů,
C₂₋₁₀ alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

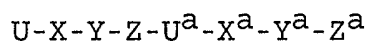
R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:

vodíku, (C_1-C_5) alkylu, (C_1-C_5) alkyl-arylu,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,

$\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$,
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$,
 $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
 fenylu nebo benzylu;

$\text{R}^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,
 fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $\text{R}^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému

jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $NR^aS(O)_2R^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_{1-8} alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_{1-8} alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,
O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
amino,
 C_1 - C_8 alkyl- NR^{10} ,
hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušený NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1 - C_8 alkylu,
 C_1 - C_8 alkylarylu,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

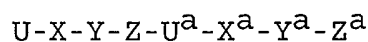
CH nebo N,
přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

2. Sloučenina podle nároku 1 kde

R^1 se zvolí z:

$-CO_2H$, $-C(O)NHOH$, $-C(O)NHOR^7$, $-SH$, $-CH_2CO_2R^7$, $-COR^7$,
 $-N(OH)COR^7$, $-SN_2H_2R^7$, $-SONHR^7$, $-CH_2CO_2H$, $-PO(OH)_2$,
 $-PO(OH)NHR^7$, $-CH_2SH$, $-C(O)NHOR^7$, $-CO_2R^7$
a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,
 $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,

C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

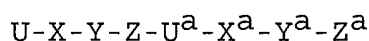
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl , F , Br , I , $=O$, CN , NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl , F , Br , I , $=O$, CN , NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členný heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N , O a S ;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O , NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H , C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H , O , NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H , C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N , O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H , O , NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

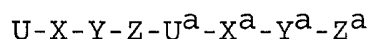
alternativně, R^a a R^{a-} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $NR^aS(O)_2R^{a-}$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:
vodíku,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkylu, alkylarylů, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,
 C_1-C_8 alkylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_1-8 alkenylu,
 C_1-C_8 alkylarylů substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího
 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,
 O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
 amino,
 C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,
 hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušovaný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkylu,
 C_1-C_8 alkylarylů,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

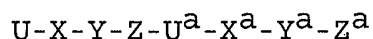
CH nebo N,
 přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

3. Sloučenina podle nároku 1, kde

R^1 se zvolí z:

$-CO_2H$, $-C(O)NHOH$, $-C(O)NHO R^7$, $-SH$, $-CH_2CO_2 R^7$
 a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,

$\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{a}}$,
 $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$, $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$ a $\text{NR}^{\text{a}}\text{SO}_2\text{NR}^{\text{a}}$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^{a} , $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^{b} a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^{b} ;

U^{a} chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^{a} , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$,
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})\text{O}$,
 $\text{NR}^{\text{a}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$, $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}\text{NR}^{\text{a}}$, $\text{NR}^{\text{a}}\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$ a $\text{NR}^{\text{a}}\text{SO}_2\text{NR}^{\text{a}}$;

X^{a} chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^{a} chybí nebo se zvolí z H, O, NR^{a} , $\text{S}(\text{O})_{\text{p}}$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^{a} chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^{c} a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^{c} ;

R^{a} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

$\text{R}^{\text{a}'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

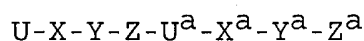
alternativně, R^{a} a $\text{R}^{\text{a}'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému

jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$,
 $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

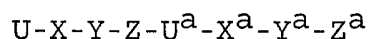
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
 jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
 N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
 Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
 Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 ,
 CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému
 obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
 který zahrnuje N, O a S;

R^4 se zvolí z:
vodíku,

R^5 a R^6 se nezávisle zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy

vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých prekurzorových derivátů

A se zvolí z:

SO_2 , SO, CHOH;

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

$\text{C}_1\text{-C}_8$ alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

$\text{C}_1\text{-}_8$ alkenylu,

$\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylarylů substituovaného 0 až 5 R^b ,

$\text{C}_3\text{-C}_{13}$ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;

amino,

$\text{C}_1\text{-C}_8$ alkyl- NR^{10} ,

hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušovaný NR^{10} , O, S(O)_m .

R^{10} se zvolí z:

vodíku,

$\text{C}_1\text{-C}_8$ alkyly,

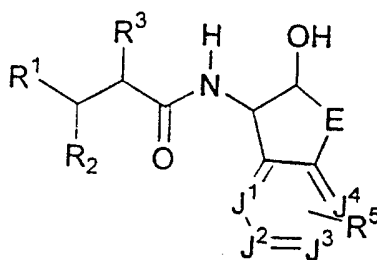
$\text{C}_1\text{-C}_8$ alkylarylů,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,

příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

4. Sloučenina obecného vzorce II



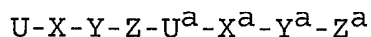
Obecný vzorec II

nebo její farmaceuticky přijatelná sůl nebo stereoizomer,
kde

R^1 se zvolí z:

$-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHO}R^7$, $-\text{SH}$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2R^7$
a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$,
 $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $\text{C}(\text{O})$, $\text{C}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})$,
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})$, $\text{OC}(\text{O})\text{O}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{O}$,
 $\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

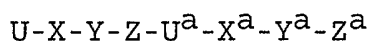
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) , C(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$, $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$, S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O) , C(O)O , OC(O) , C(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)}$, OC(O)O , OC(O)NR^a , $\text{NR}^a\text{C(O)O}$, $\text{NR}^a\text{C(O)NR}^a$, S(O)_p , $\text{S(O)}_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S(O)}_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O) ;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

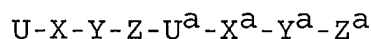
R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O)NR^a, NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O,
NR^aC(O)NR^a, S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^C;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkylu,
fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkylu,
fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkylu, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃ a CF₂CF₃;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkylu, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, NR^aS(O)₂R^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému
obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,

který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-6} alkyly, alkylarylu, a obvyklých
prekurzorových derivátů

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_{1-8} alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_{1-8} alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,

5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;

amino,

C_{1-8} alkyl- NR^{10} ,

hydroxylu,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,

C_{1-8} alkyly,

C_{1-8} alkylarylu,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,

příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

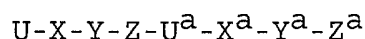
5. Sloučenina podle nároku 4, kde

R^1 se zvolí z:

-C(O)NHOH,

a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů, C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů, C_{2-10} alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

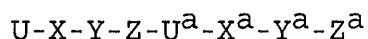
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,

$S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

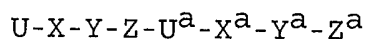
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až

1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkinylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$,

$C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
 substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
 heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
 vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu,
 fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
 jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
 N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
 Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a ,
 Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$,
 $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 ,
 CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému
 obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
 který zahrnuje N, O a S;

R^7 se zvolí z: C_{1-10} alkyly, alkylaryly, a obvyklých
prekurzorových derivátů

E je $(CR^8R^9)_m-W-(CR^8R^9)_n$,

kde W může chybět nebo se zvolí z:

CH_2 , CO, O, $S(O)_m$ a NR^{10} ,

m je 0 až 2,

n je 0 až 2;

s tím, že když W je O, S nebo NR^{10} , potom m nesmí být 0;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,

C_1-C_8 alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_{1-8} alkenylu,

C_1-C_8 alkylaryly substituovaného 0 až 5 R^b ,

C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího

1 až 4 heteroatomy vybraného ze skupiny obsahující N,

O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;

amino,

C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,

hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,

C_1-C_8 alkyly,

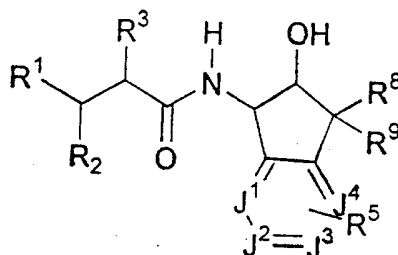
C_1-C_8 alkylaryly,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,

příčemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

6. Sloučenina obecného vzorce III



Obecný vzorec III

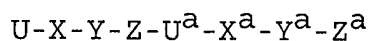
nebo její farmaceuticky přijatelná sůl nebo stereoizomer
kde:

R^1 se zvolí z:

-C(O)NHOH,

a z běžných derivátů proléčiv;

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a ,
 $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenů, C_{2-10} alkenylenů,
 C_{2-10} alkinylenů;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0

až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O)NR^a, NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O,
NR^aC(O)NR^a, S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenu, C₂₋₁₀ alkenylenu,
C₂₋₁₀ alkinylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^C a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkylu,
fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkylu,
fenylu nebo benzylu;

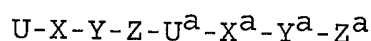
alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až
1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující
N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkylu, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃ a CF₂CF₃;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkylu, OR^a,
Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a'}, C(O)R^a, C(O)OR^a,
C(O)NR^aR^{a'}, NR^aS(O)₂R^{a'}, S(O)₂NR^aR^{a'}, S(O)_pR^a, CF₃,
CF₂CF₃, a 5 až 14 členného heterocyklického systému

obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru,
který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a ,
 $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O),
C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$,
 $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy

vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^C ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

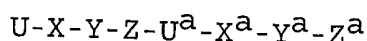
$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkyleny, C_{2-10} alkenyleny,

C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

$R^{a'}$, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a $R^{a'}$ společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , $NR^aR^{a'}$, $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a'}$, $NR^aS(O)_2R^{a'}$, $S(O)_2NR^aR^{a'}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,
 C_{1-8} alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_{1-8} alkenylu,
 C_{1-8} alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího
 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N,
 O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
 amino,
 C_{1-8} alkyl- NR^{10} ,
 hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

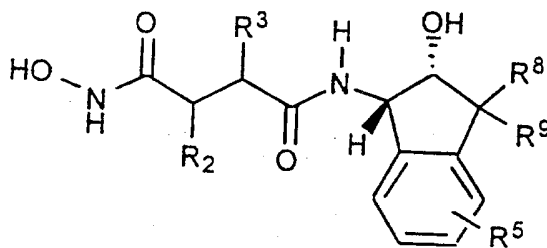
R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_{1-8} alkyly,
 C_{1-8} alkylarylu,

J^1 , J^2 , J^3 , J^4 se nezávisle zvolí z:

CH nebo N,
 přičemž cyklus neobsahuje více než dva atomy N.

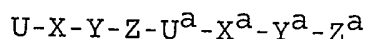
7. Sloučenina obecného vzorce IV



Obecný vzorec IV

nebo její farmaceuticky přijatelná sůl nebo stereoisomer
kde:

R^2 se zvolí ze vzorce



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$,
 $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$,
 $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu,
 C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku
substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného
heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy
vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0
až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$,
 $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$,

$\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a$, $\text{S}(\text{O})_p$, $\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^a$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{NR}^a\text{SO}_2\text{NR}^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $\text{S}(\text{O})_p$ a $\text{C}(\text{O})$;

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

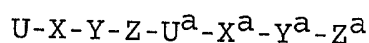
R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a R^{a-} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^{a-}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^{a-}$, $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^{a-}$, $\text{NR}^a\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a-}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^{a-}$, $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členný heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^3 se zvolí ze vzorce:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b ;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) NR^a , $NR^aC(O)$, OC(O)O, OC(O) NR^a , $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C_{3-13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c ;

R^a , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkyly,

fenylu nebo benzylu;

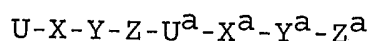
R^{a-} , při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C_{1-4} alkylu, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a R^{a-} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 a CF_2CF_3 ;

R^c , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkylu, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^{a-} , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^{a-}$, $NR^aS(O)_2R^a$, $S(O)_2NR^aR^{a-}$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^5 se zvolí z:



kde:

U chybí nebo se zvolí z: O, NR^a , $C(O)$, $C(O)O$, $OC(O)$, $C(O)NR^a$, $NR^aC(O)$, $OC(O)O$, $OC(O)NR^a$, $NR^aC(O)O$, $NR^aC(O)NR^a$, $S(O)_p$, $S(O)_pNR^a$, $NR^aS(O)_p$ a $NR^aSO_2NR^a$;

X chybí nebo se zvolí z H, C_{1-10} alkylenu, C_{2-10} alkenylenu, C_{2-10} alkynylenu;

Y chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a , $S(O)_p$ a $C(O)$;

Z chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^b;

U^a chybí nebo se zvolí z: H, O, NR^a, C(O), C(O)O, OC(O), C(O)NR^a, NR^aC(O), OC(O)O, OC(O)NR^a, NR^aC(O)O, NR^aC(O)NR^a, S(O)_p, S(O)_pNR^a, NR^aS(O)_p a NR^aSO₂NR^a;

X^a chybí nebo se zvolí z H, C₁₋₁₀ alkylenů, C₂₋₁₀ alkenylenů, C₂₋₁₀ alkinylenů;

Y^a chybí nebo se zvolí z H, O, NR^a, S(O)_p a C(O);

Z^a chybí nebo se zvolí z H, C₃₋₁₃ karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^c a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O a S substituované 0 až 5 R^c;

R^a, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly, fenylu nebo benzylu;

R^{a-}, při každém výskytu se nezávisle zvolí z H, C₁₋₄ alkyly, fenylu nebo benzylu;

alternativně, R^a a R^{a-} společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány tvoří 5 nebo 6 členný kruh obsahující 0 až 1 dalších heteroatomů vybraných ze skupiny zahrnující N, O a S;

R^b, při každém výskytu se nezávisle zvolí z C₁₋₆ alkyly, OR^a, Cl, F, Br, I, =O, CN, NO₂, NR^aR^{a-}, C(O)R^a, C(O)OR^a, C(O)NR^aR^{a-}, S(O)₂NR^aR^{a-}, S(O)_pR^a, CF₃ a CF₂CF₃;

R^C , při každém výskytu se nezávisle zvolí z C_{1-6} alkyly, OR^a , Cl, F, Br, I, =O, CN, NO_2 , NR^aR^a , $C(O)R^a$, $C(O)OR^a$, $C(O)NR^aR^a$, $NR^aS(O)_2R^a$, $S(O)_2NR^aR^a$, $S(O)_pR^a$, CF_3 , CF_2CF_3 , a 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahující 1 až 4 heteroatomy vybrané ze souboru, který zahrnuje N, O a S;

R^8 a R^9 se nezávisle zvolí z:

H,
 C_1-C_8 alkyly substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_{1-8} alkenylu,
 C_1-C_8 alkylarylu substituovaného 0 až 5 R^b ,
 C_3-C_{13} karbocyklického zbytku substituovaného 0 až 5 R^b ,
 5 až 14 členného heterocyklického systému obsahujícího 1 až 4 heteroatomy vybrané ze skupiny obsahující N, O, a S, substituovaného 0 až 5 R^b ;
 amino,
 C_1-C_8 alkyl- NR^{10} ,
 hydroxyly,

R^8 a R^9 také mohou tvořit kruh přerušný NR^{10} , O, $S(O)_m$.

R^{10} se zvolí z:

vodíku,
 C_1-C_8 alkyly,
 C_1-C_8 alkylarylu.

8. Sloučenina podle nároku 1, která je vybrána ze souboru, který zahrnuje:

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanylyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanylyl]-N4-hydroxy-2(R)-isobutyl-3(S)-5-(hydroxykarbonyl)-pentanamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl-
-3 (S) -methylbutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl-
-3 (S) -propylbutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -hexyl-
-3 (S) -propylbutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-hydroxy-
fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-methoxy-
fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-hydroxyfenyl)methyl] -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-fenyl-
propyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (benzyloxy) -fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
- (benzyloxy) -fenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (fluorfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3,4-
- (methylenedioxyfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (methoxyphenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (3 -
-trifluormethylphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-terc.butylaminosulfonylphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-methoxyphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 -
- (phenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [(3 -
-hydroxy-4-methoxyphenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3 - (3 -
-thiofen) isoxazolin] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-chlorphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-benzofuran) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-methylphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3, 4 -
- (methylenedioxyphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4 - (2 -
-tetrazolphenyl) phenyl] methyl] butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-methylfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-(aminofenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyloxykarbonyl)amino]fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-hydroxymethylen)fenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4,5-trimethoxyfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dimethoxyfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,5-dichlorfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-trifluormethylfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-isopropylfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dichlorfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-chlor-4-fluorfenyl)fenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(p-toluensulfonilamino)fenyl)methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -fenylmethyl-3-
(S) - (terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3, 4-
-methylenedioxyfenyl) fenyl]methyl] -3 (S) - (terc.butyloxykarbonyl-
amino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-methoxyfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-fluorfenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (fluor-
fenyl)methyl] -3 (S) - (terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-
fenyl)methyl] -3 (S) - (terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-nitrofenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
- (methylsulfonylamino) -fenyl) fenyl]methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl)methyl] -3 (S) - (3-trimethylsilylpropyl)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl)methyl] -3 (S) - (3-trimethylsilylpropyl) -
butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl)methyl] -3 (S) - (2, 2-dimethylpropionamido) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (ethyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (isobutyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (propionamido) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (1-methylcyklopropankarboxamido-1 -
-yl) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino) -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) - (methylsulfonylamino) butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 -
- (hydroxyfenyl) methyl] -3 (S) -aminobutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4 -
- (methylsulfonylamino) fenyl) methyl] butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl -
butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl-3 (S) -
- (5-hydroxykarbonyl) pentanamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl-3 (S) -
-methylbutandiamid;

15.02.00

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -isobutyl-3 (S) -
-propylbutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -hexyl-3 (S) -
-propylbutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-hydroxy-
fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-methoxy-
fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4- (hydroxyfenyl)methyl] -
butandiamid

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-fenyl-
propyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (benzyloxy) fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
- (benzyloxy) fenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (hydroxyfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4-
- (fluorfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3,4-
- (methylenedioxyfenyl)methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (methoxyfenyl)methyl]butandiamid;

18.02.00

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-trifluormethylphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-terc.butylaminosulfonylphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-methoxyphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (phenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
-hydroxy-4-methoxyphenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3- (3-
-thiofen) isoxazolin]]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-chlorphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-benzofuran) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-methylphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3, 4-
- (methylenedioxyphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (2-
-tetrazolphenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[3-
-phenyl) phenyl]methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[3-methylphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[4-aminophenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(benzyloxykarbonyl)amino]phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-hydroxymethylen)phenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,4,5-trimethoxyphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4,-dimethoxyphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3,5-dichlorphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2-trifluormethylphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-isopropylphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(2,4-dichlorphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(3-chlor-4-fluorphenyl)phenyl)methyl]butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[[4-(p-toluensulfonylamino)phenyl)methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) -fenylmethyl-
-3 (S) - (terc.butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4-
- (3,4-methylenedioxyfenyl) fenyl] methyl] -3 (S) - (terc.-
butyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
methoxyfenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (fluorfenyl) methyl] -3- (S) - (terc.butyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3-
- (hydroxyfenyl) methyl] -3- (S) - (terc.butyloxykarbonylamino) -
butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-nitrofenyl) methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [[4- (3-
-methylsulfonylamino) fenyl) fenyl] methyl]butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-
fenyl) methyl] -3 (S) -trimethylsilylpropyl)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-
fenyl) methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropionamido)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-
fenyl) methyl] -3 (S) - (ethyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-
fenyl) methyl] -3 (S) - (isobutyloxykarbonylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (propionamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-methylcyklopropan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (methylsulonylamino)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) -aminobutandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklobutan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-hydroxymethylisobutanamid)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-hydroxylcyklopropan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-fenylcyklopropan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-kyanocyklopropan karboxamido-1-yl) -

butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-fenylcyklopentan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-methylcyklohexan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-indol karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-furan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-chinolin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3,4,5-trimethoxybenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methyl-3-aminobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methyl-6-aminobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-pyridin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-(2,4-dichlorfenyl)cyklopropan

karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-(4-chlorfenyl)cyklopropan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-methylsulfonyl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methylsulfonyl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(3-kyanobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(6-chinolin karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-ethyl,3-methylpyrazol 5-karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-morfolinobenzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-chlor-4-methylsulfonylbenzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-(imidazol-1-yl)benzen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-thiofen karboxamido-1-yl)-butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-terc.butyl,3-methylpyrazol 5-karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-aminomethyl benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-hydroxylisobutanamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklopropan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklopentan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-cyklopentyl acetamido)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklohexan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-(4-N-Boc-piperaziny1-1-yl)benzen karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(4-piperaziny1-1-yl)benzenkarboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-fluor-6-chlorbenzenkarboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-aminocyklohexan karboxamido-1-yl)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-methylthioacetamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-methoxyacetamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-allylcyklopentan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-n-propylcyklopentan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-allylcyklopropan karboxamido-1-yl) -butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (8-chinolinsulfonamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (4-nitrobenzensulfonamido)butandiamid;

N1 - [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3 - (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,4-dimethyl-2-chlorpyrazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,5-dimethyl-isooxazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1-methyl-imidazol-3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (benzensulfonamido)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (1,4-dimethyl pyrazol 3-sulfonamido) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (2-methylsulfonyl benzen sulfonamido-1-yl) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklohexylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (isopropylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [4 (2-trifluor-methylfenyl) fenylmethyl] -3 (S) - (2,2-dimethylpropylamino) -butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklopentylamino)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-fenyl)methyl] -3 (S) - (cyklopropylmethyl)butandiamid;

N1- [2 (R) -hydroxy-1 (S) -indanyl] -N4-hydroxy-2 (R) - [3- (hydroxy-

fenyl)methyl]-3(S)-(benzylamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-furanmethyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-4-methylfenyl)methyl]-3(S)-(3-kyanofenylmethyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2,2-dimethylpropyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-pentyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(cyklopropylmethyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-thiofenmethyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(2-methylpropyldiamino)butandiamid;

N1-[2(R)-hydroxy-1(S)-indanyl]-N4-hydroxy-2(R)-[3-(hydroxy-fenyl)methyl]-3(S)-(1-methylcyklopropan karboxamido-1-yl)-butandiamid;

9. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 1.

10. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 2.

11. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e

t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 3.

12. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 4.

13. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 5.

14. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 6.

15. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 7.

16. Farmaceutický prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje farmaceuticky přijatelný nosič a terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 8.

17. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 1.

18. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 2.

19. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství

sloučeniny podle nároku 3.

20. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 4.

21. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 5.

22. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 6.

23. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 7.

24. Způsob léčby zánětlivé nemoci u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 8.

25. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo agrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 1.

26. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo agrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 2.

27. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 3.

28. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 4.

29. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 5.

30. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 6.

31. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 7.

32. Způsob léčení stavu nebo nemoci vyvolané MMP a/nebo TNF a/nebo aggrekanázou u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 8.

33. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárním glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze

u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 1.

34. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 2.

35. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 3.

36. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 4.

37. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze

u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 5.

38. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 6.

39. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 7.

40. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k revmatické artritidě, osteoartritidě, periodontitidě, gingivitidě, korneální ulceraci, růstu pevného nádoru a invazi nádorů sekundárními metastázemi, neovaskulárnímu glaukomu, násobné skleróze nebo psoriáze u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinného množství sloučeniny podle nároku 8.

41. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í

s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 1.

42. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 2.

43. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 3.

44. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 4.

45. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahují k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 5.

46. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo

nemoc se vztahuje k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 6.

47. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahuje k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 7.

48. Způsob léčení stavu nebo nemoci, kde tento stav nebo nemoc se vztahuje k horečce, kardiovaskulárním účinkům, hemoragii, koagulaci, kachexii, anorexii, alkoholismu, akutní fázové odezvě, akutní infekci, šoku, odmítnutí transplantátu, autoimunní nemoci nebo infekci HIV u savce, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se podá uvedenému savci v případě potřeby takové léčby terapeuticky účinné množství sloučeniny podle nároku 8.